(19)日本図特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11)特許出願公開番号 特開2000-1487 (P2000-1487A)

(43)公開日 平成12年1月7日(2000.1.7)

(51) Int.Cl.7	徽別記号		F	1			テーマコード(参考)
C 0 7 D 417/	12		C 6	7 D 417/12			
A61P 3/	10		A 6	1 K 31/00		603N	
3/	04					603K	
3/	06					603L	
9/	10					609G	
		審查請求	有	請求項の数27	OL	(全168頁)	最終質に続く

(21)出顧番号 特欄平11-150312 (71)出職人 000001856

(62)分割の表示 特額平8-137930の分割 三共株式会社 (22)出版日 平成8年5月31日(1996.5.31) 東京都中央区日本橋本町

22)出顧日 平成8年5月31日(1996.5.31) 東京都中央区日本橋本町3丁目5番1号 (72)発明者 藤田 岳

(31)優先権主張番号 特爾平7-135097 東京都島川区広町1丁目2番58号 三共株

(32)優先日 平成7年6月1日(1995.6.1) 式会社内

(33) 優先権主張隊 日本 (JP) (72) 発明者 和田 邦厳

(31) 優先権主張番号 特顯平8-45845 東京都品用区広町1丁目2番58号 三共株

(32)優先日 平成8年3月4日(1996,3.4) 式会社内

(33)優先権主張照 日本 (JP) (74)代理人 100081400 弁理士 大野 彰夫 (外2名)

最終頁に続く

(54) [発明の名称] 総合被案環話導体

(57) 【契約】

【課題】 優れた血糖低下作用等を有する縮合複素環化 合物の提供。

【解決手段】一般式(1)

[(E1]

を育する総合複素原化合物またはその場。 (気や、Xは ベイミダゾール環基を示し、銃暴よ1ないしち側の 後述する魔独分(a)を有していてもよい。 Yは酸素原 子などを示す。 2はチアゾリジンー2、4ージオンー5 ーイルメチル基などを示す。 Rは木素能了などを示す。 加は1ないしちの整数を示す。 置換分(a) はアルキル 基などを示す。 【特許請求の新聞】 【請求項1】 一般式(1) [(61]

* を有する総合複素環化合物またはその塩、上記式中、 Xはベンズイミダゾール環様を示し、誘葉は1ないし5 側の後述する脳機分(a)を有していてもよい。Yは酸 素原子または硫黄原子を示す。 Z は

[4:2]

網状*、しくは分枝雑状のアルキル紙、炭素粉1ないし4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハ ロゲン原子、ヒドロキシ絲、ニトロ糕、置換分(b)を 有していてもよいアミノ縣(該置換分(b)は炭素数1 ないし8個を有する直鎖状もしくは分材鎖状のアルキル 基、炭素数7ないし11個を有する直鎖状もしくは分校 鎖状のアラルキル基、炭素数6ないし10個を有するア リール紙、炭素数1ないし11億を有する資館状もしく は分枝鎖状の脂肪族アシル基、炭素数8ないし12個を 有する芳香脂肪族アシル無または炭素数7ないし11個 30 を有する芳香族アシル基を示す。) または炭素数7ない し11個を有する直鍋状もしくは分枝鍋状のアラルキル 基を示す。mは1ないし5の整数を示す。ここに、置換 分(a)は炭素数1ないし4個を有する面鎖状もしくは 分特難状のアルキル糕、炭素粉 1 ないし 4 幅を有する前 鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ベンジルオキシ 基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アセトキシ基、フェ ニルチオ基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしく は分枝鎖状のアルキルチオ基、トリフルオロメチル基、 ニトロ基、霰換分(b)を有していてもよいアミノ基 (該置換分(b) は炭素数1ないし8個を有する直鎖状 もしくは分枝鋼状のアルキル基、炭素数7ないし11個 を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアラルキル基。 歌奏 数6ないし10個を有するアリール基。炭素数1ないし 11個を有する函額状よしくは分材類状の脂肪能アシル 基、炭素数8ないし12個を有する芳香脂肪族アシル基 または炭素数7ないし11個を有する芳香族アシル基を 示す。)、置換分(c)を有していてもよい炭素数6な いし10個を有するアリール基(該護換分(c)は炭素

を示す。Rは水素原子、炭素数1ないし4個を有する直 20 キル豚、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分 枝錯状のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基。 ニトロ越、フェニル基、トリフルオロメチル基、置換分

(b) を有していてもよいアミノ基(b)、または置換分 (c)を有していてもよい炭素数7ないし11個を有す

る直籍状もしくは分材額状のアラルキル風を示す。但 し、上記縮合複素環化合物またはその場から、5~ [4 一(6ーメトキシー1ーメチルベンズイミダゾールー2 ーイルメトキシ)ベンジル〕チアゾリジン~2、4~ジ オンまたはその塩を除く。

【請求項2】 「請求項1」において、Rが水素原子、 炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の アルキル基、炭素数 1 ないし 4 個を有する面鎖状もしく は分枝鎖状のアルコキシ葉、ハロゲン原子である縮合物 素環化合物またはその塩、

【請求項3】 「糖水道1] において、Yが酸素原子で ある総合被素環化合物またはその塩、

[請求項4] [請求項1] において、Zが2、4-ジ オキソチアゾリジン…5…イルメチル糕、2、4~ジオ キソチアゾリジン-5-イリデニルメチル基または2, 40 4ージオキソオキサゾリジン-5ーイルメチル基である 縮合複素環化合物またはその塩。

[請求項5] 「結束項1] において、

Rが水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もし くは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有す る直鎖状もしくは分粒鎖状のアルコキシ基。ハロゲン原 子であり、

Yが勝率原子であり、 Zが2、4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル 基、2、4 -- ジオキソチアゾリジン -- 5 -- イリデニルメ 3

ルメチル基である縮台複素環化合物またはその塩。

「請求項1] において、Zが2, 4-ジ [請求項6] オキソチアゾリジン…5…イルメチル越または2. 4… ジオキソチアゾリジン…5 -- イリデニルメチル雄である 総合複素器化合物またはその塩。

【請求項7】 「請求項1〕において、Rが水素原子、 メチル基、メトキシ基、エトキシ基、フッ素原子または 塩素原子である縮合複素膨化合物またはその塩。

[請求項1] において、mが1ないし3 【緒衆項8】 の整数である総合複素環化合物またはその塩。

【請求項9】 「請求項1」において、

Yが酸素原子であり、

Zが2、4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル基 または2、4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニル メチル鉱であり、

Rが水素原子、メチル基、メトキシ基、エトキシ基、フ ッ素原子または塩素原子であり、

mが1ないし3の整数である縮合複素環化合物またはそ の場。

【商求項10】 5個の下記談換分(a')を有していてもよいベンズイ ミダゾール環域: 置換分(a') は炭素数 1 ないし 4 個 を有する面鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル糕。 協索粉 1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコ キシ糕、ベンジルオキシ糕、ハロゲン腕子 フェニルチ 才基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝 鎖状のアルキルチオ鞋、トリフルオロメチル鞋、ヒドロ キシ糕、アセトキシ糕、ベンジル揺またはフェニル様で ある、である総合複素環化合物またはその塩。

ジオキソオキサゾリジン-5-イルメチル基である縮合 複素環化合物またはその塩。

[請求項1] において、Rが水素原 【糖汞項12】 子、メチル基またはメトキシ基である総合資素環化合物 またはその塩。

[請求項13] 「請求項1」において、 Xが1ないし5個の下記置換分(a')を有していても よいベンズイミダゾール環基: 置換分(a') は炭素数 1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキ ル基、炭素数 1 ないし 4 個を有する直鑽状もしくは分枝 40 鎖状のアルコキシ糕、ベンジルオキシ基、ハロゲン原 ア、フェニルチオ基、炭素数1ないし4個を有する直鎖 状もしくは分粒鎖状のアルキルチオ基 トリフルオロメ チル基、ヒドロキシ基、アセトキシ基、ベンジル基また はフェニル基である、であり、

Yが酸素原子であり、

7が2. 4ージオキソオキサゾリジンー5ーイルメチル 基であり、

Rが水素原子、メチル基またはメトキシ基であり、

(1) ffi.

【講求項14】 「講求項1」において、Xが1ないし 5個の下記讚換分(a'')を有していてもよいベンズイ ミダゾール環基:置換分(a'')はメチル糕、エチル 基、イソプロビル基、メトキシ基 エトキシ基、プロボ キシ基、イソプロポキシ基、ベンジルオキシ基、フッ素 原子、塩素原子、フェニルチオ基、メチルチオ基、エチ ルチオ様、ヒドロキシ様、アセトキシ様、ペンジル加ま たはフェニル基である、である総合複素環化合物または 10 その塩。

【請求項15】 [請求項1] において、Rか水素原子 である縮合複素環化合物またはその塩。

[請求項1] において、mが1または [請求項16] 2 である総合複楽環化合物またはその塩。

【請求項17】 「請求項1〕において、

Xが1ないし5個の下記器換分(a'')を有していても よいベンズイミダゾール環基:置換分(a¹) はメチル 基、エチル基、イソプロピル基、メトキシ基、エトキシ 基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ベンジルオキシ [請求項1] において、Xが1ないし 20 基、フッ素原子、塩素原子、フェニルチオ基、メチルチ オ基、エチルチオ基、ヒドロキシ基、アセトキシ基、ベ ンジル越またはフェニル越である。であり、

Y が酸素膜子であり...

Zが2. 4 -- ジオキソチアゾリジン -- 5 -- イルメチル様 であり.

Rが水楽原子であり、

mが1または2である縮合複素環化含物またはその塩。 【請求項18】「請求項1]において、Xが1ないし5 傷の下泥器換分(a''')を有していてもよいベンズイ 【請求項11】 [[請求項1] において、2が2.4 - 30 ミダゾール環基:鑞換分(a''') はメチル基、メトキ シ基、ヒドロキシ基、アセトキシ基またはペンジル基で ある、である総合複素環化合物またはその塩。

> 【請求項19】 [請求項1] において、mが1である 縮合複素理化合物またはその塩。

【請求項20】 [請求項1] において、

Xが1ないし5個の下影響換分(a''')を有していて もよいベンズイミダゾール環基: 置換分(a''') はメ チル基、メトキシ基、ヒドロキシ基、アセトキシ基また はベンジル基である、であり、

Yが酸素原子であり.

Zが2、4 -ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル基 であり、

Rが水素順子であり。

mが1である縮合複素環化合物またはその塩。

【満東項21】 5…「4…(1…メチルベンズイミダ ソールー2ーイルメトキシ) ベンジル チアゾリジンー 2. 4ージオンまたはその趣。

5- [4-(5-メトキシー1-メチルベンズイミダゾ ールー2 - イルメトキシ) ベンジル チアゾリジンー

5- [4-(1-ベンジルベンズイミダゾール-5-イルメトキシ) ベンジル] チアゾリジン-2, 4-ジオンまたはその塩。

【繍ま項23】 5- [4-(5-メトキシー1-メチ ルベンズイミダゾール-2-イルメトキシ) ベンジル] チアゾリジン-2、4-ジオンまたはその塩。

【請求項24】 5- [4-(1-ベンジルベンズイミ ダゾールー5-イルメトキシ) ベンジル] チアゾリジン --2、4-ジオンまたはその塩。

【請求項25】 5- [4-(5-ヒドロキシ-1, 4,6,7-テトラメチルペンズイミダゾール-2-イ 20 ルメトキシ) ペンジル] チアゾリジン-2,4-ジオン またはその痒。

【請求項26】 5- 『4--(5--アセトキシー1, 4,6,7-テトラメチルベンズイミダゾールー2ーイ ルメトキシ)ベンジル』チアゾリジン-2,4-ジオン またはその塩。

【請求項27】 [請求項1]ないし[請求項26]のいずれか1項に記載された縮合複素環化合物もしくはその塩を有効成分して含有する医薬。

【発明の詳細な説明】

[0001]

【発明の属する技術分野】本発明はインスリン抵抗性、高脂血症、高血糖症、妊娠糖尿病(gestationaldiabete s mellitus :G D M)、肥満症、転精能不全(impaire d glucose tolerance:I G T)状態、糖尿精合併症

(倒えば制限法、智益、神経症、白内障、延動脈疾患 等)、動脈硬化症、白内離ねよび多嚢腫卵巣症候群(po bysystic ovarysyndrome: PCO5)等を改善し、更 にアルドース重元酵素阻害作用、5-リポキシゲナーゼ 間害作用および過糖化脂質上減抑制作用を有する新規な 40 縮合複素解化分類またその個に関する。

参、アレルギー性疾患、喘息、G 1 液瘍、心血管性疾患 (例えば虚曲性心疾患等)、アテローム性動脈硬化症お よび虚曲性疾患により惹起される細型損傷(例えば卒中 により惹起される脳損傷等)等の予防薬および/または 治療薬に関する。

[0003]

【従来の技術】従来、雑尿病、高血糖症治療薬として、 インシュリンおよびトリブタミド、ゲリビシド等のスル ホニル尿素化合物が使用されているが、最近、インシュ リン非核存性熱尿病治療薬として、チアゾリジンジオン 経緯体が知られている。

(1) 血糖低下作用を有するアアソリジン化合物としては、数多くのものが知られている。例えば特別則55-22636号(特公間62-42903号)以下、KA NAMINE 5. Cheu. Pharu. Bull.、30巻、3580-3600頁(1982年)、ヨーロッパ詩音公開第0441605年左どである。

(2) 更に、複素環基を含む化合物としては、例えば特別留61-286376号、特別平5-213913号、W092/078504号(-特表更6-502144号)、W092/07839A号(-特表更6-502146号)、特別昭61-85372号、特別平1-131169号、特別平2-83384号などに開示されている。

(3) また、血糖低下作用を育するオキサゾリジンー 2、4ージオン化合物が、特開平3-170478号、 WO92/02520A号などに開示されている。

(4) 更に、Nーヒドロキシウレイド基または3.5 = 30 ジオキソオキサジアゾリジンー2ーイルメチルフェニル基を含む化合物で削減の活性を有する化合物が、WO92/03425A号(=特表平5-508654号)に 開示されている。

【0004】 しかし、これらの化合物は、活性が十分でない、安全性に問題を有する。等の欠点を有する。そして臨床上、さらに強力で安全なこれら疾病の予防薬および/または治療薬が望まれている。

【0005】そして、チアゾリジン系化合物と各種疾病の関係が、例えば以下に示す文献に記載されている。

【0 0 0 6】 高血糖症に対するチアプリジン系化合物の作用がPhabetes、32(9)_604-810(1983): Diabetes、37 (11)_1549-1558(1988): Prog.Clin.Biol.Res.255,177-192(1988): Metabolism.37(3)_276-280(1988): Arznei mittelforschung.40(1)_37-42(1980): Arzneimittelforschung.40(2 Pt 1)_156-162(1990): Arzneimittelforschung.40(3)_253-267(1990) などで報告されている。

【0007】高脂血症に対するチアゾリジン系化合物の 作用がDiabetes.,40(12),1669-1674(1991); An.J.Physi ol.,267(1 Pr.1),E95-E101(1994); Diabetes.,43(10),1

【0008】副糖能不全、インスリン抵抗性に対するチ アソリジン系化合物の作用がArzneisittelforschung..4 0(2 Pt 1),156-162(1990); Metabolism.,40(10),1025-1 230(1991): Diabetes., 43(2), 204-211(1994): N.Engl. J. Med., 331(18), 1226-1227(1994) などで報告されてい 3.

【0009】高血圧症に対するチアゾリジン系化合物の 作用がWetabolism., 42(1), 75~80(1993); Am. J. Physio 1.,265(4 Pt 2),R726-R732(1993); disbetes,43(2),204 -211(1994)などで報告されている。

【〇〇10】 無波質に対するチアゾリジン系化合物の作 用がEndocrinology., 135(5), 2279-2282(1994); Endocri nology、136(4)、1474~1481(1995)などで報告されてい \$.

【0.0.1.1】 緊症に対するチアゾリジン系化合物の作用 が糖尿病、第38巻臨時増刊号(1995年)で報告さ れている。

【0012】 寂動脈疾巣に対するチアゾリジン系化合物 の作用がAm. J. Physiol. . 265(4 Pt. 2) . R726-R732(1993); Rypertension.、24(2),170~175(1994)などで報告されて 20 式(1) いる。

【0013】動脈硬化症に対するチアゾリジン系化合物 の作用がAm. J. Physiol. 、265(4 Pt 2) 、R726-R732(1993) で報告されている。

【0014】更に、近年、凝縮能不全を伴わないインス リン抵抗性を有する正常人が糖尿病を発症するリスクが 高い「インスリン抵抗性非耐糖能不全 (insulin resist anthon-IGT:NGT)という。 ことがM.Engl.L.Med..3 31(18),1226-1227(1994) で報告されている。インスリ 発症の予防薬として有用であることが示唆される。

[0015]

【発明が解決しようとする契額】 本発明者らは、インス リン抵抗性、高脂血症、高血糖症、妊娠糖尿病、肥満 征、耐糖能不全状態、糖尿病合併症、動脈硬化症, 白内 論および多番階卵巣症候群等を改善し、更にアルドース* * 還元酵素阻害作用、5-リボキシゲナーゼ阻害作用およ び漢酸化脂質生成抑制作用を有する誘導体の合成とその 薬理活性について鋭意研究をおこなった結果、新規な縮 合物素類化合物が優れた薬理活性を有することを見出し て本発明を完成した。

【0016】更に、本発明のほかの目的は、該総合複素 環化合物および/またはその塩を有効成分として含有す る高斯血症、高血繊症、肥満症、函糖能不全、高血圧 症、骨粗鬆症、悪液質、脂肪肝、糖尿病合併症、動脈硬 10 化症、白内障等の予防薬および/または治療薬、および 上記疾病以外の、妊娠糖尿病、多薬抑卵単症は群等のよ うなインスリン抵抗性に起因する疾病の予防薬および/ または治療薬、ならびに炎症性疾患、アクネ、日焼け、 佐癬、湿疹、アレルギー性疾患、喘息、GI潜瘍、心血 管件存填。アテローム性動脈硬化症および虚曲性疾患に より煮起される細胞樹傷等の予防薬および/または治療 薬を提供することにある。

[0017]

【課題を解決するための手段】本発明は、(1) 一般

[0018]

[住3]

$$X \longrightarrow (CH_2) \longrightarrow Y \longrightarrow Z$$
(1)

を有する総合複素環化合物またはその塩に関する。

【0019】 但し、式中、 X はベンズイミダゾール環基 ン抵抗性を改善する医薬は上湿のような正常人の糖尿病 30 を示し、該基は1ないし5個の後述する置換分(a)を 有していてもよい。

【OO20】Yは稼事原子または硫黄原子を示す、

f00211 Ztt

[0022]

14:41

(以下、これらを 2、4-ジオキソチアゾリジン-5 ーイリデニルメチル基、2、4ージオキソチアゾリジン

ンー5 …イルメチル糕、 3. 5 - ジオキソオキサジア ゾリジン-2-イルメチル基およびN-ヒドロキシウレ

【0023】 Rは水素原子、炭素数1ないし4個を有す る直谿状もしくは分枝鎖状のアルキル基。炭素数1ない し4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ 基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、置換分

(b) を有していてもよいアミノ基(該置換分(b) は 炭素数 | ないし8個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の アルキル基、炭素数7ないし11個を有する直鎖状もし くは分枝鎖状のアラルキル基、炭素数6ないし10個を 有するアリール様、炭素数 1 ないし 1 1 個を有する直鎖 状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル林、炭素数8ないし 12個を有する芳香脂肪族アシル基または炭素数7ない し11個を有する芳香族アシル基を示す。) または炭素 数7ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のア ラルキル基を示す。

【0024】mは1ないし5の整数を示す。

【0025】 ここに、 器換分(a) は炭素数1ないし4 個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル核、炭素 数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鏡状のアル コキシ基、ベンジルオキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキ シ基、アセトキシ基、フェニルチオ基、炭素数1ないし 20 4個を有する面鎖状もしくは分枝類状のアルキルチオ 様、トリフルオロメチル基、二トロ様、置換分(b)を 有していてもよいアミノ結(該置換分(b)は炭素数1 ないし8個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル 展、炭素物7ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝 鎖状のアラルキル基、炭素数6ないし10個を有するア リール基、炭素数1ないし11個を有する直鎖状もしく は分粒額状の脂肪族アシル基、炭素数8ないし12個を 有する芳香脂肪族アシル基または炭素数7ないし11億 していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール 基(該置機分(c)は炭素数1ないし4個を有する直鎖 状もしくは分枝鎖状のアルキル様、炭素数1ないし4個 を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロ ゲン原子、ヒドロキシ蘇、ニトロ蘇、フェニル経、トリ フルオロメチル糕、置換分(b)を有していてもよいア ミノ基)、または置換分(c)を有していてもよい炭素 数7ないし11側を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のア ラルキル基を示す。

【0026】上記化合物中、好適な化合物は、(2) (1) において、Rが水素原子、炭素数1ないし4個を 有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1 ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキ シ紙、ハロゲン原子である総合複素環化合物またはその 塩、(3) (1) において、Yが酸素原子である縮含 複素環化合物またはその塩、および(4) (1)にお いて、 2が2、 4 ージオキソチアゾリジンー5ーイルメ チル様、2、4 - ジオキソチアゾリジン - 5 - イリデニ ルメチル基または2.4-ジオキソオキサゾリジン-5

あり、特に好適な化合物は、(5) (1)において、 Rが水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もし くは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有す る直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原 子であり、Yが酸素原子であり、Zが2、4ージオキソ チアゾリジン…5~イルメチル様、2.4~ジオキソチ アゾリジン-5-イリデニルメチル基または2、4-ジ オキソオキサゾリジン…5 ーイルメチル基である総合複 素類化合物またはその塩である。

【0027】より好適な化合物としては、(6)

(1)において、Zが2、4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル結または2、4-ジオキソチアゾリジン -5ーイリデニルメチル基である縮合複素環化合物また はその塩。(7) (1) において、Rが水素原子、メ チル基、メトキシ基、エトキシ基、フッ素原子または塩 素原子である総合複素環化合物またはその塩、および

(8) (1) において、mが1ないし3の整数である 縮合衡素環化合物またはその塩であり、特に好適な化合 物は、(9) (1)において、Yが酸素原子であり、 2が2、4ージオキソチアソリジン…5…イルメチル基 または2. 4ージオキソチアゾリジン-5-イリテニル メチル域であり、Rが水素原子、メチル域、メトキシ 基、エトキシ
基、フッ素原子または塩素原子であり、m が1、2または3である縮台複素環化合物またはその塩 である。

[0028] 更に好適な化合物は、(10) (1) 10 おいて、Xが1ないし5個の下記置換分(a))を有し ていてもよいベンズイミダゾール環様: 置換分(a') は炭素数1ないし4個を有する債績状もしくは分枝鎖状 を有する芳香族アシル基を示す。)、 置機分(c)を有 30 のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もし くは分枝鎖状のアルコキシ基、ベンジルオキシ基、ハロ ゲン原子、フェニルチオ基、炭素数1ないし4個を有す る直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、トリフル オロメチル基。ヒドロキシ基、アセトキシ基、ペンジル 基またはフェニル基である、である縮台複素環化合物ま たはその塊、(11) (1) において、Zが2, 4---ジオキソオキサゾリジンー5ーイルメチル基である縮合 複素環化合物またはその塩、および(12) (1)に おいて、Rが水素原子、メチル基またはメトキシ基であ 40 る総合線素環化合物またはその塊であり、特に好適な化 合物は、(13) (1) において、Xが1ないし5個 の下記職操分(a')を有していてもよいベンズイミダ ゾール環基: 置換分 (a') は炭素数 1 ないし 4 個を有 する南鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、房素数1な いし4個を有する債額狀もしくは分秒額状のアルコキシ 基、ペンジルオキシ基、ハロゲン原子、フェニルチオ 基、炭素数1ないし4個を育する直鎖状をしくは分枝鎖 状のアルキルチオ基、トリフルオロメチル基、ヒドロキ シ墓、アセトキシ墓、ベンジル墓またはフェニル基であ ソオキサゾリジン〜5-イルメチル様であり、Rが水素原子、メチル様またはメトキン様であり、mが1ないし 3の整数である総合機素線化台物またはその塩である。 【0029】更に好源な化合物としては、(14)

- (1) において、Xが1ないL5個の下記器機分
- (a'') を有していてもよいベンズイミダゾール環基:
- 置換分(a⁺)。はメチル根、エチル基、イソプロピル 基、メトキシ塔、エトキシ様、フロポキシ基、イソプロ 基・メトキシ様、ベンジルオキシ様、フッ素原子、集末限子、 フェニルチオ様、メチルチオ様、エチルチオ様、ヒドロ 10 キシ基、アセトキシ基、ベンジル基またはフェニル様で ある。である総合後率線化と効果とはその。(15)
- (1) において、Rが水素原子である縮合複素環化合物またはその塩、および(16) (1) において、m か1または2である縮合複素環化合物またはその塩であり、特にお適体化合物は、(17) (1) において、Xが1ないし5億の下起置機分(a") と有していてもよいベンズイミダブール環結:置接分(a") はメチル基、エチル基、イソプロゼル基、メトキシ基、ベンジルオキシ 20 基、プロボキシ基、イソプロボキシ基、ベンジルオキシ 26 基、プロボキシ基、イソプロボキシ基、アセトキン基、ベンジルμまたはフェニル基である。であり、Yが酸素原子であり、2が2、4ージオキンチアゾリジンー5ーイルメチル基である。Rが水素原子であり、mが1またはフェカムを発展、アカル基である。Rが水素原子であり、mが1または2である締合物業環化合物まである。
- 【0030】更に好適な化合物としては、(18)
- (1) において、Xが1ないし5 個の下記韻換分 (a''') を有していてもよいベンズイミダゾール環
- (1) において、mが1である総合複素環化合物またはその塩であり、特に好適な化合物は、(20) (1) において、Xが1ないし5個の下記製塊分(a''')を有していてもよいベンズイミグソール環基:器換分(a''')はメチル基、メトキシ基、ヒドロキシ基、アセトキシ基またはベンジル基である、であり、Yが検案
- (a''') はメチル種、メトキン様、ドドロキシ様、ア セトキシ基素たはベンジル基である。であり、Yが酸素 駅子であり、Zが2、4ージオキソチアソリジン-5ー イルメチル基であり、Rが水素原子であり、mが1であ 40 る総合複素欄化合物またはその塩である。

【0032】 本発明の新規な「除薬」、「インスリン抵 抗性に起因する疾病の予防薬および/または治療薬」、「 活血輸売予防薬および/または治療薬」、「動脈硬化症予 防薬および/または治療薬」、「動脈硬化症予 防薬および/または治療薬」、「動脈硬化症予 り、 「大きたは治療薬」、「肥満症予防薬および 、 「肥満症予防薬および/または治療 薬」、「繊維体不全予防薬および/または治療薬」、

『高血圧症や防薬および/または治療薬』、「多囊限卵 果地検許予防薬および/または治療薬」、「妊娠解尿病 予防薬および/または治療薬」、「妊娠解尿病 一般などの、または治療薬」、「治療性所 患予防薬および/または治療薬」、「治療性所 患予防薬および/または治療薬」、「治療性所 が/または治療薬」は、上記(1)ないし(26)に記 報の結合提素型化合物またはその地を有効成分として合 育する。ここに、Xがベンズイミダノール環基をごす場 合、該ベンズイミダノール環基としては、例えば1ーベ ンズイミダゾリル、2ーベンズイミダゾリル、6ーベンズ イミダゾリル、5ーベンズイミダゾリル、6ーベンズ イミダゾリル、7ーベンズイミダゾリルなどをあげるこ とができる。

【0033】R、脳換分(a) および/または脳換分(c) が同一もしくは異なって、炭素数1ないし4 編を行る直流状もしくは分段数状のアルトル系を示す場合、該アルキル基としては例えば、メチル、エチル、ブロビル、イソプロビル、ブチル、イソブチル、8一ブチル、ナーブチルなどをあげることができる。好適にはメチル、エチルであり、最適にはメチルである。

【0034】R、競換分(a) および/または無換分(c) が同一もしくは異なって、炭素数1ないし4個を行する直鎖状もしくは分校難状のアルコキシ基を示す場合、該アルコキシ基としては例えば、メトキシ、エトキシ、ブロボキシ、イソブロボキシ、インブトキン。まつチャシ、キーブトキン。などができる。好適にはメトキシ、エトキシ、アあり、最適なはメトキシ、エトキシであり、より好適にはメトキシ、エトキシであり、最適なはメトキシアある。

【0035】R、微換分(a) および/または微換分 (c) が同…もしくは異なって、ハロゲン原子を示す場 合、該ハロゲン原子としては臭素原子、塩素原子、フッ 素原子などをあげることができる。好適には塩素原子、 【0036】R、 遊換分(a) および/または置換分

(り) か同一もしくは異なって、炭素数 7 ないし 1 個を育するアラルキル様を示す場合、該アラルキル様としては、アルキン窓分が炭素数 1 ないしち 個を育する資 鎌状もしくは分枝鍛状のアルキレンであり、例えば、ペンジル、2 ーフェニルエチル、1 ーフェニルブエデル、3 ーフェニルブロビル、4 ーフェニルブラゲル、1 ーフェニルブラル、5 ーフェニルベンチル、1 ーナフェニルブチル、5 ーフェニルベンチル、1 ーナフチルメチル、2 ーナフチルメチルなどをあげることができる。好適にはべ 10 ンジルである。

【0037】R、顕接分(a) および/または置換分(c)が同一もしくは異なって、置換分(b)を有していてもよいアミノ基を示す場合において、置換分(b)

1) 炭素数1ないし8個を有する直鎖状もしくは分枝鎖 状のアルキル種を示す場合、該アルキル種としては例え ば、メチル、エチル、プロビル、イソプロビル、プチ ル、イソプチル、sープチル、tープチル、ペンチル、 2 - ペンチル、3 - ペンチル、2 - メチルブチル、3 -メチルブチル、1、1ージメチルプロピル、1、2ージ メチルプロピル、2、2 - ジメチルプロピル、ヘキシ ル、2 -- ヘキシル、3 -- ヘキシル、2 -- メチルペンチ ル、3-メチルペンチル、4-メチルベンチル、1、1 -ジメチルプチル、1、2 --ジメチルプチル、1、3 --ジメチルブチル、2、2-ジメチルブチル、2、3-ジ メチルブチル、3、3-ジメチルブチル、1、1、2-トリメチルプロビル、1、2、2-トリメチルプロビ ル、ヘプチル、2 …ヘプチル、3 …ヘプチル、4 …ヘプ チル、3、3-ジメチルベンチル、オクチル、1-メチ 30 ルヘプチル、2…エチルヘキシル、1、1、3、3…テ トラメチルプチルなどをあげることができる。好適には 労事数1ないし6個を有する直絶状もしくは分移線状の アルキル基である。 提適には炭素数1ないし4個を有す る前鎖状もしくは分材鎖状のアルキル線である。特に器 適にはメチル基、エチル基である。

【0038】2) 映素数7ないし11個を有する直鎖状 もしくは分枝類状のアラルキル様を示す場合、該アラル キル基としては上記製換分(a)で述べたアラルキル基 と同じである。

【0039】3)炭素数6ないし10個を有するアリー ル基を示す場合、該アリール基としては、例えばフェニ ル、1ーナフチル、2ーナフチルなどをあげることがで きる。

【004 40】4)炭素数1ないし11個を有する直鎖状 もしくは分核蜘球の脂肪族アシル基を示す場合、該糖肪 族アシル基としては、例えばポルミル、アセチル、プロ ピオニル、ブチリル、インブチリル、ピパロイル、ペン タノイル、ヘキサノイル、ヘブタノイル、オクタノイ げることができる。好適にはホルミル、アセチル、プロ ピオニル、ブチリル、イソブチリル、ピバロイル、ヘキ サノイルである。

【0041】5)炭素数8ないし12 鍋を有する芳香酢 肪族アシル基を示す場合。 該芳香酯脂族アシル基として は、倒えばフェニルアセチル、3ーフェニルプロピオニ ル、4ーフェニルブチリル、5ーフェニルベンタノイ ル、6ーフェニルペキサノイル、α エメチルフェニルア セチル、α、α -ジメチルフェニルアセチルなどをあげ ることができる。好適にはフェニルアセチルなどのあり

【0042】6)炭素数7ないし11個を有する著香族 アシル基を示す場合、該芳香族アシル基としては、例え ばペンゾイル、1ーナフトイル、2ーナフトイルなどを あげることができる。好演にはヘンゾイルである。

【0043】従って、ここにR、置換分(a) および/ または置換分(c) が同一もしくは異なって、置換分 (b) を有していてもよいアミノ基を示す場合、該アミ /基としては例えば以下のような基をあげることができ

【0044】1) メチルアミノ、エチルアミノ、プロビ ルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、イソプ チルアミノ、sープチルアミノ、tープチルアミノ、ベ ンチルアミノ、2…ペンチルアミノ、3…ペンチルアミ ノ、2-メチルプチルアミノ、3-メチルプチルアミ ノ、1、1ージメチルプロピルアミノ、1、2ージメチ ルプロビルアミノ、2、2 -- ジメチルプロビルアミノ、 ヘキシルアミノ、2ーヘキシルアミノ、3ーヘキシルア ミノ、2-メチルペンチルアミノ、3-メチルペンチル アミノ、4 -- メチルベンチルアミノ、1、1 --- ジメチル ブチルアミノ、1、2-ジメチルプチルアミノ、1、3 ージメチルプチルアミノ、2、2ージメチルプチルアミ ノ、2、3-ジメチルブチルアミノ、3、3-ジメチル ブチルアミノ、1、1、2ートリメチルプロピルアミ ノ、1、2、2ートリメチルプロビルアミノ、ヘプチル アミノ、2-ヘブチルアミノ、3-ヘプチルアミノ、4 …ヘプチルアミノ、3、3…ジメチルペンチルアミノ、 オクチルアミノ、1ーメチルヘブチルアミノ、2ーエチ ルヘキシルアミノ、1、1、3、3ーテトラメチルブチ ルアミノのような水素原子とアルキルとの組み合わせか 40 らなる顕換アミノ基をあげることができる。

【0045】2) ベンジルアミノ、2-フェニルエチル アミノ、1--フェニルエチルアミノ、3-フェニルプロ ビルアミノ、2-フェニルプロビルアミノ、1-フェニ ルプロビルアミノ、4-フェニルブチルアミノ、1-フ ェニルブチルアミノ、5-フェニルペンチルアミノ、1 -ナフチルメチルアミノ、2-ナフチルメチルアミノの ような水素原子とアラルキルとの組み合わせからなる置 換アミノ様をあげることができる。

【0046】3) フェニルアミノ、1ーナフチルアミ

の組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0047】4) ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ、イソブチリルアミノ、ヘリフテリルアミノ、ヘキリイルアミノ、ヘキリイルアミノ、ヘアタノイルアミノ、カンデカノイルアミノ、ウンデカノイルアミノのような水薬原子と脂肪疾アシルとの組み合わせからなると微形をことができる。

【0048】5)フェニルアセチルアミノ、3・フェニルプロピオニルアミノ、4・フェニルブチリルアミノ、5・フェニルベメタノイルアミノ、6・フェニルペキリノイルアミノ、α・α・ジメチルフェニルアセチルアミノのような水楽駅子と芳香脂肪族アンルとの組み合わせからなる霞横アミノ基をあげることができる。

【0049】6) ベンゾイルアミノ、1ーナフトイルア ミノ、2ーナフトイルアミノのような水素原子と芳香族 アシルとの親み合わせからなる遺換アミノ基をあげるこ とができる。

【0050】7) ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N - メチルーN - エチルアミノ、N - メチルーN ーペンチ ルアミノのようなアルキルとアルキルとの組み合わせか らなる選復すミノ基をあげることができる。

 $\{0051\}$ 8) N \cdots エチル・N \cdots ベンジルアミノ、N \cdots トー・フェール・N \cdots ステル・N \cdots ステル・N

【0053】10) NープロビルーNーアセチルアミ ノ、NーベンチルーNープロビオニルアミノ、Nーエチ ルーNーヘキサノイルアミノのようなアルキルと脂肪族 アシルとの類み合わせからなる選換アミノ基をあげるこ とができる。

【①0.5 4】1 1) NーエチルーNーフェニルアセチル アミノ、NーイソプロピルーNー(2ーフェニルプロピ オニル)アミノ、NーメチルーNー(6ーフェニルヘキ 40 Nープロピオニルアミノ、NーブチリルーNーヘキサノ サノイル)アミノのようなアルキルと労害無断族アシルとの組み合わせからなる醒検アミノ基をあげることができる。 そこ、 「20.6 6.1 23、NーアサチルーNーフィエルアセチ

【0055】 12) NーメチルーNーペンゾイルアミ ノ、NーsーブチルーNーペンゾイルアミノ、Nーペブ チルーNーペンゾイルアミノのようなアルキルと芳香族 アシルとの綴み合わせからなる劉検アミノ場をあげるこ とができる。

【0056】13) ジベンジルアミノ、N-ベンジルー

N-(2-ナフチルメチル) アミノのようなアラルキル とアラルキルとの組み合わせからなる関換アミノ基をあ げることができる。

【0057】14) N--ペンジルーN--フェニルアミ ノ、N--(3--フェニルプロビル) ーN--フェニルアミ ノのようなアラルキルとアリールとの組み合わせからな る観像アミノ基をあげることができる。

【0059】16) NーペンジルーNーフェニルアセチルアミノ、NーペンジルーNー(4ーフェニルブチリル) アミノのようなアラルキルと芳香脂肪族アシルとの 別からわせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0060】17) N--ベンジル-N--ベンゾイルアミ 入、N--(2-フェニルエテル) - N--ベンゾイルアミ フ ノのようなアラルキルと芳香族アシルとの組み合わせか らなる護揆アミノ基をあげることができる。

【0061】18) ジフェニルアミノ、Nー (1ーナフ チル) ーNーフェニルアミノ、Nー (2ーナフチル) ー Nーフェニルアミノのようなアリールとアリールとの組 み合わせからなる顕換アミノ基をあげることができる。 【0062】19) NーフェニルーNーアセチルアミ ノ、NーフェニルーNープロビオニルアミノ、Nーフェ ニルーNーへキサノイルアミノのようなアリールと脂肪 旅アシルとの組み合わせからなる酸換アミノ基をあげる ことができる。

【0063】20) NーフェニルーNーフェニルアセチ ルアミノ、NーフェニルーNー(4ーフェニルブチリ ル)アミノのようなアリールと汚養脂肪族アシルとの組 み合わせからなる顕微アミノ基をあげることができる。 【0064】21) NーフェニルーNーベンソイルアミ ノ、NーフェニルーNー(2ーナアトイル)アミノのよ うなアリールと芳香族アシルとの組み合わせからなる置 像アミノ基をおげることができる。

【0065】22)ジアセチルアミノ、Nーアセチルー
N一プロピオニルアミノ、NーブチリルーNーへキサノ
イルアミンのような脂肪族アシルと脂肪族アシルとの親
み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。
【0066】23)NーアセチルーNーフェニルブセチ
ルアミノ、NーアセチルーNー(4ーフェニルブサリ
ルアミノ、NーブチリルーNーフェニルアセチルアミ
ノのような脂肪族アシルと汚香脂肪族アシルとの親み合
わせからなる微像アミノ基をあげることができる。
【0067】24)NーアセチルーNーペンゾイルアミ

【0067】24)N-アセチル-N-ベンゾイルアミ ノ、N-ブチリル-N-(2-ナフトイル) アミノのよ る穀換アミノ基をあげることができる。

【0068】25) N、Nージフェニルアセチルアミノ、N-フェニルアセチルーN-(2-フェニルアコ オニル) アミノ、N-フェニルアセチルーN-(4-フ ェニルブチリル) アミノのような芳香脂肪族アシルと芳 香脂肪族アシルとの組み合わせからなる蜜換アミノ基を あげるととができる。

【0069】26) NーフェニルアセチルーNーベンゾ イルアミノ、NーフェニルアセチルーNー(2ーナフト イル)アミノのような芳香脂肪族アシルと芳香族アシル 10 との組み合わせからなる饗換アミノ基をあげることがで きる。

【0070】27) ジベンゾイルアミノ、Nーベンゾイ ルーNー(2ーナフトイル)アミノのような芳香族アシ ルと芳香族アシルとの組み合わせからなる蹊換アミノ基 なあげることができる。

【0071】 劉検分(a)か、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分検鎖状のアルキルチオ基を示す場合、酸アルキルチオ基としては例えば、メチルチオ、エテルチオ、プロビルチオ、イソプロビルチオ、ブチルチ などをあげることができる。韻検り(a)が、韻検分

(c) を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基を下す場合、該アリール基としては、例え ばフェニル、1ーナフチル、2ーナフチルなどをあげる ことができる。

【0072] 更に顕換分(c) が炭素数1ないし4個を 有する直鎖状もしくは分枚類状のアルキル族、炭素数1 ないし4個を有する直鎖状もしくは分枚類状のアルコキシ毛、ハロゲン原子、ヒドロキシ結、ニトロ基、フェニ 30 ル基、トリフルセロメチル基、鍛換り(b)を有してい でもよいアミノ旅である場合、炭素数1ないし4個を有 する直鎖状もしくは分枝類状のアルキル基、炭素数1な いし4個を有する直鎖状もしくは分枝類状のアルコキシ 基、ハロゲン膜子、脚除分(b)を有していてもよいア ミノ豚については、既に前迷した。

【0073】そこで置換分(a)が、置換分(c)を有していてもよい誤業数6ないし10個を有するアリール 展を示す場合、該アリール基としては例えば以下のよう な基を終することができる。

ル、4-イソプロビル-2-ナフチル、5-ブチル-2 ーナフチル、8-イソブチル-2-ナフチル、4-5-ブチル-2-ナフチル、5-t-ブチル-2-ナフチル のような炭素数1ないし4個を有する南頭状もしくは分 検鎖状のアルキルを有するアリール株:

2) 例えば、4~メトキシフェニル、4~エトキシフ ェニル、4ープロポキシフェニル、4ーイソプロポキシ フェニル、4ープトキシフェニル、4ーイソプトキシフ ェニル、4-s-ブトキシフェニル、4-t-ブトキシ フェニル、4 -- メトキシ -- 1 -- ナフチル、5 -- エトキシ ---1--ナフチル、8--プロポキシ--1--ナフチル、4--イソプロポキシー 1 ーナフチル、5 ープトキシー1 ーナ フチル、4ーイソプトキシー1ーナフチル、4ー5ープ トキシー1ーナフチル、4-1-ブトキシー1ーナフチ ル、4-メトキシー2-ナフチル、5-エトキシー2-ナフチル、8 - プロポキシー2 - ナフチル、4 - イソプ ロポキシー2ーナフチル、5ープトキシー2ーナフチ ル、8-イソプトキシー2-ナフチル、4-5-プトキ シー2ーナフチル、5-tープトキシ-2-ナフチルの ような炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝 鎖状のアルコキシを有するアリール基:

- 4) 例えば、2-ヒドロキシフェニル、3-ヒドロキ シフェニル、4-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシ ー1-ナフチル、5-ヒドロキシーーナフチル、8-ヒドロキシー1-ナフチル、4-ヒドロキシー2-ナフ チル、5-ヒドロキシー2-ナフチル、8-ヒドロキシ -2-ナフチルのようなヒドロキシを有するアリール 40 基:
 - 5) 例えば、2ーニトロフェニル、3ーニトロフェニル、4ーニトロフェニル、4ーニトロー・ナフチル、5ーニトロー1ーナフチル、8ーニトロー1ーナフチル、4ーニトロー2ーナフチル、5ーニトロー2ーナフチル、8ーニトロー2ーナフチルのようなニトロを育するアリール基:
 - 6) 例えば、3 ーフェニルフェニル、4 ーフェニルフ エニル、4 ーフェニルー1ーナフチル、5 ーフェニルー 1 ーナフチル、8 ーフェニルー1 ーナフチル、4 ーフェ

--フェニル--? --ナフチルのようなフェニルを有するア リール紙:

- 7) 例えば、3ートリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、4ートリフルオロメチル -- 1 -- ナフチル、5 -- トリフルオロメチル・・1 -- ナフチ ル、8-トリフルオロメチルー1-ナフチル、4-トリ フルオロメチルー2ーナフチル、5ートリフルオロメチ ルー2 "ナフチル、8 "トリフルオロメチルー2 "ナフ チルのようなトリフルオロメチルを有するアリール基;
- 8) 例えば2…アミノフェニル、3…アミノフェニ ル、4-アミノフェニル、4-アミノ-1-ナフチル、 8 -- アミノ -- 2 -- ナフチルのような無置換アミノを有す るアリール棋、脳棒アミノを有するアリール基として lt.
- 例えば3-メチルアミノフェニル、4-エチルアミ ノフェニル、3ープロビルアミノフェニル、3ーイソプ ロピルアミノフェニル、4-ブチルアミノフェニル、3 ーイソブチルアミノフェニルのような水素原子とアルキ ルとの組み合わせからなる職換アミノを有するアリー 11:
- 11)例えば4ーベンジルアミノフェニル、4ー(2-フェニルエチルアミノ) フェニル、4-(1-フェニル エチルアミノ)フェニル、4…(4-フェニルブチルア ミノ) フェニル、4~(1~ナフチルメチルアミノ) フ エニルのような水素粒子とアラルキルとの組み合わせか らなる微換アミノを有するアリール;
- 111)例えば4ーフェニルアミノフェニル、4ー(1 ーナフチルアミノ)フェニルのような水素原子とアリー ルとの組み合わせからなる器換アミノを有するアリー 111 :
- 1 v) 例えば4-ホルミルアミノフェニル、4-アセチ ルアミノフェニル、4ープチリルアミノフェニル、4ー ピバロイルアミノフェニル、4-ヘキサノイルアミノフ ェニル、4ーオクタノイルアミノフェニル、4ーウンデ カノイルアミノフェニルのような水素原子と脂肪族アシ ルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアリー 12:
- v) 例えば4-フェニルアセチルアミノフェニル、4-(4-フェニルブチリルアミノ) フェニル、4-(6-チルフェニルアセチルアミノ)フェニル、4-(a, α ージメチルフェニルアセチルアミノ) フェニルのような 水素原子と芳香脂肪能アシルとの組み合わせからなる鑽 換アミノを有するアリール;
- v i) 例えば4ーペンプイルアミノフェニル、4ー (1 ーナフトイルアミノ) フェニル、4-(2-ナフトイル アミノ) フェニルのような水素原子と芳香族アシルとの 組み合わせからなる置換アミノを有するアリール:
- vii) 例えば4-ジメチルアミノフェニル、4-ジエ

- ミノ) フェニルのようなアルキルとアルキルとの組み合 わせからなる顕微アミノを有するアリール:
- v i i i i 傾えば 4 -- (N-エチル-N-ベンジルアミ フェニル、4 ー (N-t-ブチルーN-ベンジルア ミノ)フェニル、4 -- (N -- ヘキシル -- N -- ベンジルア ミノ)フェニルのようなアルキルとアラルキルとの組み 合わせからなる置換アミノを有するアリール;
- 1x) 捌えば4~(N~メチル~N~フェニルアミノ) フェニル、4 -- (N-オクチル-N-フェニルアミノ)
- 10 フェニルのようなアルキルとアリールとの組み合わせか らなる器様アミノを有するアリール:
 - x) 例えば4~(N-プロピル-N-アセチルアミノ) フェニル、4--(N-エチル-N-ヘキサノイルアミ
 - ノ)フェニルのようなアルキルと脂肪族アシルとの組み 合わせからなる網絡アミノを有するアリール:
- x 1) 例えば 4 -- (N-エチル--N-フェニルアセチル アミノ) フェニル、4- [N-メチル-N-(6-フェ ニルヘキサノイル) アミノ! フェニルのようなアルキル と芳香脂肪族アシルとの組み合わせからなる蜜換アミノ 20 を有するアリール:
- g 1 1) 倒えば 4 ー (NーメチルーNーベンゾイルアミ ノ)フェニル、4-(N-ヘプチルーN-ベンゾイルア ミノ)フェニルのようなアルキルと装着裤アシルとの組 み合わせからなる脳換アミノを有するアリール;
 - x 1 1 1) 例えば 4 -- ジベンジルアミノフィニル 4 --「N-ベンジル-N-(2-ナフチルメチル)アミノ フェニルのようなアラルキルとアラルキルとの組み合わ せからなる器機アミノを有するアリール;
- x i v) 例えば 4 ··· (N ··· ベンジル ·· N ··· フェニルアミ 30 ノ)フェニル、4- [N-(3-フェニルプロピル)-N-フェニルアミノ) フェニルのようなアラルキルとア リールとの組み合わせからなる顕摘アミノを有するアリ m/L:
 - x v) 例えば 4 (N-ベンジル-N-アセチルアミ ノ)フェニル、4ー (NーペンジルーNーペンタノイル アミノ) フェニルのようなアラルキルと脂肪族アシルと の組み合わせからなる置換アミノを有するアリール; x v +) 例えば4- (N-ベンジルーN-フェニルアセ
- チルアミノ) フェニル、4- [N-ペンジル-N-(4 フェニルヘキサノイルアミノ) フェニル、4-(α-メ 40 -フェニルブチリル) アミノ [フェニルのようなアラル キルと芳香脂肪族アシルとの組み合わせからなる職換ア ミノを有するアリール:
 - x v i i) 解えば 4 -- (N-ベンジルーN-ベンゾイル アミノ) フェニル、4- [N-(2-フェニルエチル) -N-ベンゾイルアミノ! フェニルのようなアラルキル と芳香族アシルとの組み合わせからなる関換アミノを有 するアリール:
 - x v i i i) 例えば 4 (ジフェニルアミノ) フェニ ル、4 ー [N ー (2 ーナフチル) ーN ーフェニルアミ

せからなる窗換アミノを有するアリール;

- x i x) 例えば 4 (N-フェニル-N-アセチルアミ ノ) フェニル、4- (N-フェニル-N-ヘキサノイル
- アミノ) フェニルのようなアリールと脂肪族アシルとの 組み合わせからなる器様アミノを有するアリール:
- xx) 例えば4- (N-フェニル-N-フェニルアセチ ルアミノ) フェニル、4- [N-フェニル-N-(4-フェニルブチリル) アミノ! フェニルのようなアリール と答番脂肪族アシルとの認み合わせからなる鬱麹アミノ を有するアリール:
- xx1) 例えば4--(N-フェニル-N-ベンゾイルア ミノ)フェニルのようなアリールと芳香族アシルとの組 み合わせからなる躍物アミノを有するアリール:
- x x i i) 例えば4ージアセチルアミノフェニル、4ー (N-ブチリル-N-ヘキサノイルアミノ) フェニルの ような脂肪族アシルと脂肪族アシルとの組み合わせから なる
 讃換アミノを有するアリール;
- x x 1 1 1) 例えば 4 ··· (N · アセチル · N · フェニル アセチルアミノ) フェニル、4-(N-プチリル-N-フェニルアセチルアミノ)フェニルのような脂肪族アシ 20 ルと芳香脂肪族アシルとの組み合わせからなる器様アミ ノを有するアリール:
- xx + v) 例えば 4 ··· (N ··· アセチル ··· N ···· ベンゾイル アミノ) フェニル、4-「N-プチリル-N-(2-ナ フトイル) アミノ) フェニルのような脂肪能アシルと質 香族アシルとの組み合わせからなる微操アミノを有する アリール:
- xxv) 例えば4-(N、N-ジフェニルアセチルアミ ノ)フェニル、4… [N-フェニルアセチルーN-(4) 肪能アシルと芳香脂肪族アシルとの組み合わせからなる 器換アミノを有するアリール:
- x x v i) 例えば 4 ー (N ーフェニルアセチルーN ーベ ンゾイルアミノ) フェニル、4- [N-フェニルアセチ ルーNー (2ーナフトイル) アミノ! フェニルのような 芳香脂肪族アシルと芳香族アシルとの組み合わせからな る置換アミノを有するアリール;
- x x v + i) 例えば 4 ージベンゾイルアミノフェニル、 4- [N-ベンゾイル-N-(2-ナフトイル)アミ ノ) フェニルのような芳香族アシルと芳香族アシルとの 40 フチルメチル、4ーイソプロポキシー1ーナフチルメチ 組み合わせからなる置換アミノを有するアリール;を挙 げることができる。
- 【0074】 置換分(a)か、置換分(c)を有してい てもよい炭素数7ないし11個を有するアラルキル基を 示す場合、該アラルキル基としては、アルキレン部分が 炭素数1ないし5個を有する函額状もしくは分枝類状の アルキレンであり、例えば、ベンジル、2-フェニルエ チル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、2 ーフェニルプロピル、1ーフェニルプロピル、4ーフェ

- ル、1ーナフチルメチル、2ーナフチルメチルなどをあ げることができる。
- 【0075】更に微換分(c)が炭素数1ないし4個を 有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル様、炭素数1 ないし4個を有する直鎖状もしくは分材鎖状のアルコキ シ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、フェニ ル糕、トリフルオロメチル様、置換分(b)を有してい てもよいアミノ基である場合、炭素数1ないし4個を有 する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数 1 な 10 いし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ 基、ハロゲン原子、置換分(b) を有していてもよいア ミノ基については、既に前述した。
 - 【0076】そこで置換分(a)が、置換分(c)を有 していてもよい炭素数7ないし11個を有するアラルキ ル基を示す場合、該アラルキル基としては例えば以下の ような基を挙げることができる。
- 例えば、4ーメチルベンジル、4ーエチルベンジ ル、4 - プロビルベンジル、4 - イソプロビルベンジ ル、4ープチルベンジル、4ーイソプチルベンジル、4 -s-ブチルベンジル、4-t-ブチルベンジル、4-メチルー1ーナフチルメチル、5-エチルー1ーナフチ ルメチル、8ープロピルー1ーナフチルメチル、4ーイ ソプロピルー 1 ーナフチルメチル、5 ー ブチルー 1 ーナ フチルメチル、4ーイソプチルー1ーナフチルメチル、 4~s~ブチル--1--ナフチルメチル、4…+--ブチル -1-ナフチルメチル、4-メチルー2-ナフチルメチ ル、5-エチルー2-ナフチルメチル、8-プロビルー 2ーナフチルメチル、4ーイソプロピルー2ーナフチル メチル、5 -- プチル -- 2 -- ナフチルメチル、8 -- イソブ …フェニルブチリル)アミノ!フェニルのような著香脂 30 チルー2ーナフチルメチル、4−s ープチルー2ーナフ チルメチル、5-1-プチル-2-ナフチルメチルのよ うな炭素数1ないし4個を有する液鏑状もしくは分枝鎖 状のアルキルを有するアラルキル禁:
 - 2) 例えば、4ーメトキシベンジル、4-エトキシベ ンジル、4ープロポキシベンジル、4ーイソプロポキシ ベンジル、4 -- プトキシベンジル、4 -- イソプトキシベ ンジル、4-5-プトキシベンジル、4-1-プトキシ ベンジル、4-メトキシー1-ナフチルメチル、5-エ トキシー1ーナフチルメチル、8ープロポキシー1ーナ ル、5-プトキシー1-ナフチルメチル、4-イソプト キシー1ーナフチルメチル、4~5~プトキシー1ーナ フチルメチル、4…+…ブトキシ…1…ナフチルメチ ル、4-メトキシー2-ナフチルメチル、5-エトキシ -2-ナフチルメチル、8-プロポキシ-2-ナフチル メチル。4-イソプロポキシ-2-ナフチルメチル、5 ープトキシー2ーナフチルメチル、8-イソプトキシー 2-ナフチルメチル、4-s-ブトキシ-2-ナフチル メチル、5-1-ブトキシ-2-ナフチルメチルのよう

のアルコキシを有するアラルキル墓:

- 3) 例えば、4 一臭化ペンジル、4 塩化ペンジル、 4 - フッ化ペンジル、4 - 沃化ペンジル、3 - 塩化ペン ジル、3 -- フッ化ベンジル、3 -- 臭化ペンジル、3 -- 沃 化ペンジル、4 …臭化…1 -- ナフチルメチル、4 -- 塩化 --1-ナフチルメチル、4-フッ化-1-ナフチルメチ ル、4-沃化-1-ナフチルメチル、5-塩化-1-ナ フチルメチル、5-フッ化-1-ナフチルメチル、5-奥化-1-ナフチルメチル、8-塩化-1-ナフチルメ チル、4…フッ化…2…ナフチルメチル、4…窒化…2 10 らなる置換アミノを有するアラルキル; ーナフチルメチル、4 一塩化 -- 2 -- ナフチルメチル、4 一沃化-2-ナフチルメチル、5-奥化-2-ナフチル メチル、5一塩化ー2ーナフチルメチル、5ーフッ化ー 2ーナフチルメチル、5ー沃化-2-ナフチルメチルの ようなハロゲン額子を有するアラルキル基:
- 4) 例えば、2-ヒドロキシベンジル、3-ヒドロキ シペンジル、4 -- ヒドロキシベンジル、4 -- ヒドロキシ -1-ナフチルメチル、5-ヒドロキシ-1-ナフチル メチル、8-ヒドロキシー1-ナフチルメチル、4-ヒ ナフチルメチル、8-ヒドロキシ-2-ナフチルメチル のようなヒドロキシを有するアラルキル様:
- 5) 例えば、2…ニトロベンジル、3…ニトロベンジ ル、4-ニトロベンジル、4-ニトロー1-ナフチルメ チル、5 -- ニトロー1 -- ナフチルメチル、8 -- ニトロー 1ーナフチルメチル、4-ニトロー2ーナフチルメチ ル、5-ニトロー2ーナフチルメチル、8-ニトロー2 ーナフチルメチルのようなニトロを有するアラルキル 雄:
- ンジル、4-フェニル-1-ナフチルメチル、5-フェ ニルー1ーナフチルメチル、8-フェニルー1ーナフチ ルメチル、4-フェニル-2-ナフチルメチル、5-フ ェニルー2ーナフチルメチル、8ーフェニルー2ーナフ チルメチルのようなフェニルを有するアラルキル魅:
- 7) 例えば、3-トリフルオロメチルベンジル、4-トリフルオロメチルベンジル、4--トリフルオロメチル ー1ーナプチルメチル、5ートリフルオロメチルー1ー ナフチルメチル、8-トリフルオロメチル-1-ナフチ ル、5-トリフルオロメチル-2-ナフチルメチル、8 ートリフルオロメチルー2 -- ナフチルメチルのようなト リフルオロメチルを育するアラルキル基:
- 8) 例えば2-アミノベンジル、3-アミノベンジ ル、4-アミノベンジル、4-アミノー1-ナフチルメ チル、8-アミノー2-ナプチルメチルのような無蹤換 アミノを有するアラルキル基:
- 道換アミノを有するアラルキル基としては、
- 1) 捌えば3-メチルアミノベンジル、4-エチルアミ

- ロビルアミノベンジル、4ープチルアミノベンジル、3 ーイソプチルアミノベンジルのような水素原子とアルキ ルとの組み合わせからなる器様アミノを有するアラルキ
- 11) 例えば4…ベンジルアミノベンジル 4… (2… フェニルエチルアミノ) ベンジル、4-(1-フェニル エチルアミノ) ベンジル、4-(4-フェニルブチルア ミノ) ベンジル、4~(1~ナフチルメチルアミノ) ベ ンジルのような水素膜マとアラルキルとの組み合わせか
- 111) 例えば4-フェニルアミノベンジル、4-(1 ーナフチルアミノ)ベンジルのような水素原子とアリー ルとの組み合わせからなる器様アミノを有するアラルキ N:
- 1 v) 倒えば4-ホルミルアミノベンジル、4-アセチ ルアミノベンジル、4-ブチリルアミノベンジル、4-ビバロイルアミノベンジル、4-ヘキサノイルアミノベ ンジル、4…オクタノイルアミノベンジル、4…ウンデ カノイルアミノベンジルのような水素原子と脂肪族アシ ドロキシー2ーナフチルメチル、5ーヒドロキシー2ー 20 ルとの組み合わせからなる鍵検アミノを有するアラルキ 11:
 - v) 倒えば4-フェニルアセチルアミノベンジル、4-(4-フェニルプチリルアミノ) ベンジル、4--(6-フェニルヘキサノイルアミノ) ベンジル、4…(α…メ チルフェニルアセチルアミノ) ベンジル、4--(α, α ージメチルフェニルアセチルアミノ)ベンジルのような 水素原子と苦香脂肪族アシルとの組み合わせからなる器 換アミノを有するアラルキル:
- v i) 例えば4…ベンゾイルアミノベンジル、4…(1 6) 例えば、3-フェニルベンジル、4-フェニルベ 30 -ナフトイルアミノ)ベンジル、4-(2-ナフトイル アミノ) ベンジルのような水素原子と芳香族アシルとの 組み合わせからなる影響アミノを有するアラルキル:
 - v i i) 例えば4ージメチルアミノベンジル、4ージエ チルアミノベンジル、4- (N-メチル-N-エチルア ミノ) ベンジルのようなアルキルとアルキルとの組み合 わせからなる影換アミノを有するアラルキル;
- viii)例えば4-(N-エチル-N-ペンジルアミ ノ)ベンジル、4ー(N-tープチルーNーペンジルア ミノ) ベンジル、4-(N-ヘキシル-N-ベンジルア ルメチル、4ートリフルオロメチルー2ーナフチルメチ 40 ミノ) ベンジルのようなアルキルとアラルキルとの総み 合わせからなる置換アミノを有するアラルキル;
 - 1x) 例えば4~(N…メチル…N…フェニルアミノ) ベンジル、4 -- (N --オクチル -- N -- ファニルアミノ) ベンジルのようなアルキルとアリールとの組み合わせか らなる習換アミノを有するアラルキル:
 - x) 例えば4-(N-プロビル-N-アセチルアミノ)ベンジル、4-(N-エチル-N-ヘキサノイルアミ ノ) ベンジルのようなアルキルと脂肪族アシルとの組み 合わせからなる嚴換アミノを有するアラルキル:

アミノ) ベンジル、4~ [N-メチル-N-(6-フェ ニルヘキサノイル) アミノ ベンジルのようなアルキル と芳香脂肪族アシルとの組み合わせからなる饕換アミノ を有するアラルキル;

- x i i) 例えば 4 … (N … メチル … N … ベンゾイルアミ ノ) ベンジル、4 -- (N-ヘプチルーN-ベンゾイルア ミノ) ペンジルのようなアルキルと芳香族アシルとの組 み合わせからなる影換アミノを有するアラルキル;
- x i i j 列えば4ージベンジルアミノベンジル、4ー 「N --ベンジル -- N --- (2 -- ナフチルメチル) アミノ ベンジルのようなアラルキルとアラルキルとの組み合わ せからなる置換アミノを有するアラルキル:
- x i v) 例えば4- (N-ベンジル-N-フェニルアミ ノ) ベンジル、4 - 「N - (3 - フェニルプロピル) -N-フェニルアミノ》 ベンジルのようなアラルキルとア リールとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラ ルキル:
- x v) 例えば 4 ··· (N ··· ベンジル ··· N ·· アセチルアミ ノ)ベンジル、4 ー (N ーベンジルーN ーベンタノイル の組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル; x v 1) 例えば4 ー (N ーベンジルーN ーフェニルアセ チルアミノ) ベンジル、4 -- 「N ---ベンジル-N---(4 フェニルブチリル)アミノ「ベンジルのようなアラル キルと芳香脂肪能アシルとの組み合わせからなる顕豫ア ミノを有するアラルキル:
- x v i i) 例えば 4 ー (NーベンジルーNーベンゾイル アミノ) ペンジル、4- [N-(2-フェニルエチル) -- N -- ベンゾイルアミノ] ベンジルのようなアラルキル するアラルキル;
- x v i i i) 様えば 4 ージフェニルアミノベンジル、4 - 「N-(2ーナッチル)-N-フェニルアミノ」ベン ジルのようなアリールとアリールとの組み合わせからな る器線アミノを有するアラルキル:
- xix) 例えば4--(N-フェニル-N-アセチルアミ ベンジル、4-(N-フェニル-N-ヘキサノイル アミノ) ベンジルのようなアリールと脂肪族アシルとの 組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル:
- ルアミノ) ベンジル、4 [N-フェニル-N-(4-フェニルブチリル) アミノ! ベンジルのようなアリール と著香脂肪能アシルとの組み合わせからなる顕微アミノ を有するアラルキル:
- x x i) 解えば 4 ~ (N ~ フェニル~ N ~ ベンゾイルア ミノ) ベンジルのようなアリールと芳香族アシルとの組 み含わせからなる懺換アミノを有するアラルキル:
- x x i i) 例えば 4 … ジアセチルアミノベンジル、4 … (N-ブチリル-N-ヘキサノイルアミノ) ベンジルの

なる置換アミノを有するアラルキル;

xx1ii) 例えば4-(N-アセチル-N-フェニル アセチルアミノ) ベンジル、4~(N-ブチリル-N-フェニルアセチルアミノ) ベンジルのような脂肪酸アシ ルと著香脂肪族アシルとの組み含わせからたる鬱練アミ ノを有するアラルキル:

xxiv) 例えば4-(N-アセチル-N-ベンゾイル アミノ) ベンジル、4---[N--ブチリル--N---(2--ナ フトイル) アミノ] ベンジルのような脂肪族アシルと芳 10 香族アシルとの組み合わせからなる讚換アミノを有する アラルキル:

xxv) 例えば4-(N、N-ジフェニルアセチルアミ ノ)ベンジル、4ー「NーフェニルアセチルーNー(4 ーフェニルプチリル) アミノ ペンジルのような苦香脂 筋能アシルと芳香瓶肪能アシルとの組み合わせからなる 置換アミノを有するアラルキル:

xxvi) 例えば4--(N-フェニルアセチル-N-ベ ンゾイルアミノ) ベンジル、4 -- 「N -- フェニルアセチ ルーNー(2ーナフトイル)アミノ]ベンジルのような アミノ) ベンジルのようなアラルキルと脂肪族アシルと 20 著番糖肪族アシルと著番族アシルとの組み合わせからな る鬱物アミノを有するアラルキル;

> xxvii) 倒えば4-ジベンゾイルアミノベンジル、 4- [N-ベンゾイル-N-(2-ナフトイル) アミ ノトベンジルのような芳香族アシルと芳香族アシルとの 組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル: を挙げることができる。

【0077】 ここに、Xが示すベンズイミダソール環基 の1位および/または2位に置換分(a)が存在する場 台、該置換分(a)は、好適には炭素数1ないし4個を と芳香族アシルとの組み合わせからなる顕換アミノを有 30 有する直翻状もしくは分枝翻状のアルキル基、脳換分

- (c)を有していてもよい炭素数6ないし10個を有す るアリール基または順換分(c)を行していてもよい炭 素数7ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝類状の アラルキル基である。
- 【0078】従って、Xが1ないし5個の巡換分(a) を有するベンズイミダゾール環基としては、例えば、1 メチルベンズイミダゾールー2ーイル、1ーエチルベ ンズイミダゾールー2ーイル、1ープロピルベンズイミ ダゾールー2ーイル、1ーイソプロピルベンズイミダゾ xx) 捌えば4-(N-フェニル-N-フェニルアセチ 40 ール-2-イル、1-ブチルベンズイミダゾール-2-イル、6-メトキシー1H-ベンズイミダゾールー2-イル、5-メトキシー1日--ベンズイミダゾールー2--イル、6 -- メトキシー1 -- メチルベンズイミダゾールー 2-イル、5-メトキシー1-メチルベンズイミダゾー ルークーイル、1ーエチルー6ーメトキシベンズイミダ ソールー2ーイル、1ーエチルー5ーメトキシベンズイ ミダソールー2ーイル、6ーメトキシー1ープロビルベ ンズイミダソールー2ーイル、5ーメトキシー1ープロ ヒルベンズイミダゾールー2ーイル、1ーイソプロビル

ソプロビルー5-メトキシベンズイミダゾールー2-イ ル、1-イソブチル-6-メトキシベンズイミダゾール ー 2 ー イル、1 ー イソプチルー5 ー メトキシベンズイミ ダゾールー2ーイル、6ーエトキシー1ーメチルベンズ イミダゾールー2ーイル、5ーエトキシー1ーメチルベ ンズイミダソールー2ーイル、1ーメチルー6ープロボ キシベンズイミダゾールー2ーイル、1ーメチルー5ー プロポキシベンズイミダゾールー2ーイル、6ーイソプ ロポキシー1-メチルベンズイミダソール-2-イル、 5 -- イソプロボキシ -- 1 -- メチルベンズイミダゾール -- 10 2 -- イル、6 -- ブトキシー1 -- メチルベンズイミダゾー ルー2ーイル、5ープトキシー1ーメチルベンズイミダ ゾールー2ーイル、6ーイソプトキシー1ーメチルベン ズイミダゾールー2ーイル、5ーイソプトキシー1ーメ チルベンズイミダゾールー2ーイル、6~ςープトキシ --1-メチルベンズイミダゾール--2-イル、5-s-ブトキシー1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、 6-1-ブトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2 ーイル、5-1-ブトキシー1-メチルベンズイミダゾ ールー2ーイル、6ープトキシー1ープロピルペンズイ 20 ミダゾールー2ーイル、5ープトキシー1ープロビルベ ンズイミダゾールー2ーイル、6-ベンジルオキシー1 …メチルベンズイミダゾール…2…イル、5…ベンジル オキシー1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5 ーメトキシー1、6-ジメチルベンズイミダゾールー2 ーイル、6ーメトキシー1、5ージメチルベンズイミダ ゾールー2ーイル、6ープロムー5ーメトキシー1ーメ チルベンズイミダゾールー2ーイル、5ープロムー6ー メトキシー1ーメチルベンズイミダゾールー2ーイル、 ゾールー2ーイル、6-エトキシー5-フルオロー1-メチルベンズイミダゾールー2ーイル、5.7ージフル オロー1ーメチルペンズイミダゾールー2ーイル、4. 6-ジフルオロー1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-フルオロー1-メチルベンズイミダゾールー 2-イル、5-フルオロー1-メチルベンズイミダゾー ルー2ーイル、5ークロロー1、6ージメチルベンズイ ミダゾールー2ーイル、6ークロロー1、5ージメチル ベンズイミダゾールー2ーイル、5ークロロー1、6-ジエチルヘンズイミダゾールー2ーイル、6ークロロー 40 1、5-ジエチルベンズイミダゾール-2-イル、5-エチルー・1 ーメチルベンズイミダゾールー2 ーイル、6 ーエチルー1ーメチルベンズイミダゾールー2ーイル。 5-プロモー1-メチルベンズイミダゾールー2-イ ル、6 - プロキー 1 - メチルベンズイミダゾールー2 -イル、7ープロモー1ーメチルー5ートリフルオロメチ ルベンズイミダゾール-2-イル、4-プロモ-1-メ チルー6ートリフルオロメチルベンズイミダゾールー2 ーイル、7-クロロー1-メチルー5-トリフルオロメ

メチルー6ートリフルオロメチルベンズイミダゾールー 2-イル、1-メチル-7-トリフルオロメチルペンズ イミダゾールー2ーイル 1ーメチルー4ートリフルオ ロメチルベンズイミダゾールー2 ーイル、1 ーメチルー 5 -- トリフルオロメチルベンズイミダゾールー2 -- イ ル、1ーメチルー6ートリフルオロメチルベンズイミダ ゾールー2ーイル、5ープロモー1、6、7ートリメチ ルベンズイミダゾールー2ーイル、6ープロモー1、 4. 5ートリメチルペンズイミダソールー?ーイル. 5 ーフルオロー6ークロロー1ーメチルベンズイミダゾー ルー2ーイル 6ーフルオロー5ークロロー1ーメチル ベンズイミダゾールー2ーイル、5ープロモー1、7-ジメチルベンズイミダゾールー2ーイル、6ープロモー 1、4-ジメチルベンズイミダゾール-2-イル、6tープチルー1ーメチルペンズイミダソールー2ーイ ル、5 -- t -- プチル-- 1 -- メチルベンズイミダゾール--2 -- イル、6 -- ヒドロキシ-- 1 -- メチルベンズイミダゾ ールー2ーイル、5ーヒドロキシー1ーメチルベンズイ ミダゾールー2ーイル、1、7 - ジメチルベンズイミダ ゾールー2ーイル、1、4ージメチルベンズイミダゾー ルー2ーイル、6、7ージクロロー1ーメチルベンズイ ミダゾールー2ーイル、4、5ージクロロー1ーメチル ペンズイミダゾール…2…イル、5.6、7…トリフル オロー1ーメチルベンズイミダゾールー2ーイル、4. 5. 6 -- トリフルオロー1 -- メチルベンズイミダゾール -2-イル、5-ブロモ-6-ベンジルオキシ-1-メ チルベンズイミダゾールー2ーイル、6ープロモー5ー ベンジルオキシー1ーメチルベンズイミダゾールー2ー イル、7-クロロー1-メチルベンズイミダゾール-2 5 - エトキシー 6 - フルオロー 1 - メチルベンズイミダ 30 ーイル、4 - クロロー 1 - メチルベンズイミダゾールー 2-イル、6-ヒドロキシー1、5、7-トリメチルベ ンズイミダゾールー2ーイル、5-ヒドロキシー1、 4. 6ートリメチルベンズイミダゾールー2ーイル、1 ーメチルベンズイミダゾールー6ーイル、1ーエチルベ ンズイミダゾールー6ーイル、1ープロピルベンズイミ ダゾールー6ーイル、1 --- イソプロビルベンスイミダゾ ールー6ーイル、1ープチルベンズイミダゾールー6ー イル、1-ベンジルベンズイミダゾール-6-イル、1 ーメチルベンズイミダゾールー7ーイル、1-エチルベ ンズイミダゾールー 7 ーイル、1 ーベンジルベンズイミ ダソールー?ーイル、1ーメチルベンズイミダソールー 4 -- イル、1 -- メチルベンズイミダゾール -- 5 -- イル、 1.2-ジメチルベンズイミダゾールー6-イル、5-ヒドロキシー1、4、6、7ーテトラメチルベンズイミ ダゾールー2ーイル、1ーエチルー5ーヒドロキシー 4. 6、7-トリメチルベンズイミダゾールー2-イ ル、1ーペンジルペンズイミダソールー5ーイル、5ー アセトキシー1、4、6、7ーテトラメチルベンズイミ ダゾール-2-イル、のようなベンズイミダゾール環

【0079】本発剛の前記一般式(1)を有する化合物 は、常法に従って駆にすることができる。そのような原 として例えば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸、沃化 水素酸のようなハロゲン化水素酸の塩;硝酸塩、過温素 酸塩、硫酸塩、燐酸塩等の無機酸塩またはメタンスルホ ン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、エタンスルホン 酸のような低級アルカンスルホン酸の塩;ベンゼンスル ホン酸、pートルエンスルホン酸のようなアリールスル ホン酸の線: ゲルタミン綾、アスパラギン鯵のようなア ミノ鯵の塩:酢鯵、フマール酸、酒石酸、蓚酸、マレイ 10 れる。例えば次に示す通りである。 ン酸、りんご酸、コハク酸、安息香酸、マンデル酸、ア スコルビン酸、乳酸、グルコン酸、クエン酸のようなカ ルボン鯵の塩、等の有機輸塩を挙げることができる。好 適には装理上許容しうる塩である。

【0080】 更に、前記一般式(1)を有する化合物 は、常法に従って金属塩にすることができる。そのよう な塩としては例えばリチウム、ナトリウム、カリウムの ようなアルカリ金属の塩;カルシウム、パリウム、マグ ネシウムのようなアルカリ土組金属の塩;アルミニウム 塩:等の無機塩を挙げることができる、好議には薬理ト 20 許容しうる塩である。

【0081】なお、前記一般式(1)を有する化合物 は、種々の異性体を有する。

【0082】即ち、2が2、4-ジオキソチアゾリジン --5-イルメチルまたは2、4-ジオキソオキサゾリジ ンー5ーイルメチル基を示す場合、該チアゾリジン環の 5位およびオキサゾリジン環の5位は不斉炭素原子であ る。前記一般式(1)においては、これら不斉炭素原子 に基づく立体異性体およびこれら異性体の等量および非* * 等量混合物がすべて単一の式で示されている。従って、 本発明においてはこれらの異性体およびこれらの異性体 の混合物をもすべて含むものである。

【0083】更に、補記一般式(1)を有する化合物に おいて、Zが2、4ージオキソチアゾリジンー5ーイル メチル、2、4 -- ジオキソオキサソリジン -- 5 -- イルメ チル、2、4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニル メチル、3、5 …ジオキソオキサジアゾリジン ~ 2 ~ イ ルメチルを示す場合、種々の互変異性体の存在が考えら

[0084]

[0085] [fk6]

[0086]

[0087] [化8]

10

前記一般式 (1) においては、これらに基づく互変異性 体およびこれらの異性体の等量および非等量混合物がす ペて単一の式で示されている。従って、本発明において はこれらの異性体およびこれらの異性体の混合物をもす ペて含むものである。

【0088】更に本発明において、前記一般式(1)を 有する化合物またはその塩が溶解剤物(例えば水和物) を形成する場合には、これらもすべて含むものである。 (2089)更に本発明において、生傷内において代謝 されて前記一般式(1)を有する化合物またはその塩に 変換される化合物、いわゆるプロドラッグもすべて含む ものである。本発明の前記一般式(1)を有する化合物を の具体例としては、例えば下部の表に記載する化合物を の具体例としては、例えば下部の表に記載する化合物を あげることができる。 [0090] 表 1 [0091] [代9]

[0092] [表1]

33				34
例示化合物 番 号	х	Y	æ	R
1-1	(C)N N N N N N	0	1	н
1-2	Z N	0	2	н
1-3	© N →	0	3	н
1-4	Ç\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	0	4	н
1-5	(N) H	0	5	MeO
1-6		s	14	н
1-7	ĊŢ <mark>ņ</mark> ≻	0	3	MeO
1-8	CI'N H	0	1	Cı
1-9	©"≻	0	-	Me

[0093] [表2]

35				
例示化合物 書 号	x	Ÿ	m	R
1-10		s	1	MeO
1-11	(C)N Me	0	l	н
112	N N Me	0	2	н
1-13	()N Ne Me	0	3	н
1-14	ĊŢ ^N ≻ Me	0	4	н
1-15	. CTV	0	5	н
1-16	(In)- Me	s	1	н
1-17	(IN)→ Me	s	2	н
1-18	(IN)→ Me	0	1	MeO

[0094] [数3]

37					38
资示化合物 番号	x	Y	m	R	
1-19	()N Ne	٥	1	EtO	
1-20	(JN) Me	0	1	СI	
1-21	₩e	0	ı	F	
1-22	N N- Me	0	1	Me	
1-23	CIN- Me	o	1.	íPr	
1-24	, CIN- Me	0	2	Et	
1-25	CIN- Me	5	ı	CI	
1-28	()N Me	5	ı	Me	
1-27	Ŭ ^N ≻	0	1	н	-

[34]

39				
例示化合物 番 号	х	Y	æ	R
1-28	(XN) Et	С	2	н
1-29	N Et	0	3	t Bu
1-30	E:	0	1	Me
1-31	Cin-	0	ž	MeO
1-32	CIN-	s	1	н
1-33	, CIN	s	1	PrO
1-34	C'h-	s	1	Me
1-35	Ŭ _N ≻ Pr	0	1	н
1-36	C√n>	0	3	H

[0096] [表5]

41				
例示化合物 番 号	х	٧	m	R
1-37	O'N Pr	0	1	F
1-38	ÇN Pr	s	1	н
1-39	ÇN i Þr	0	1	н
1-40	i þr	o	2	н
1-41	QN i pr	s	ı	н
1-42	, In-	ø	5	Cī
1-43	CIN-	0	1	н
1-44	CIN → Bu	o	4	н
1-45		s	1	н

[0097] [表6]

43				
利示化合物 番号	Х	Υ	m	R
1-46	MeO N	0	4.0	н
1-47	MeO IN	0	3	н
1-45	MeO N	s	1	н
1-49	MeO N Me	0	N.	н
1-50	MeC N Me	0	2	н
1-51	MeO CIN	0	3	н
1-52	MeO N N Me	0	4	н
1-53	MeO TN	0	5	T.
1-54	MeO No	s	ı	н

[0098] [表7]

45				
例示化合物 當 号	к	Y	m	R
1-55	MeO N	s	2	н
1-58	MeO (N)	О	1	Me
1-57	MeO Ne	0	1	MeO
i-58	MeO Ne	٥	ı	ç
1-59	MeO Ne	o	1	Cl
1-69	Meo CN	0	ı	н
1-61	MeO N Et	0	2	н
1-62	MeO N	0	ı	MeO
1-63	MeO N	s	1	н

[0099] [表8]

47				
與汞化合物 番号	x	Y	m	R
1-64	MeO N	0	746	н
1-65	MeO NPr	s	1	н
1-56	MeO CINT	0	i	н
1-67	MeO CN i Bu	0	1	н
1-68	MeO N	5	1	н
1-69	EtO N N Me	o	1	н
1-70	B t O N Me	0	ı	MeO
1-71	E 10 N N Me	٥	1	Cl
1-72	BtO N	0	2	н

[0100] [表9]

49				
資示化合物 番号	x	Y	m	R
1-73	EtO N.	0	3	н
1-74	EtO N Me	s	1	н
1-75	Eto CN	s	4	8 t
1-76	Pro N Me	0	1	н
1-77	Pro N Me	s	1	н
1-78	[PrO Ne	o	ı	н
1-79	i Pro No Me	o	3	н
1-80	BuO N N Me	0	1	н
1-81	(Bu0 TN)	o	1	н

[0101] [表10]

51				
判示化合物 番号	х	Y	m	R
1-82	sBuO N Me	0	ı	н
1-83	t BuO	0	1	н
1-84	BuO N	0	1	н
1-85	BxO N	0	1	н
1-86	MeO IN N	0		н
1-87	MeO N	0	1	н
1-88	FTTN We	o	ı	н
1-89	F N- F Me	0	***	н
1-90	, CV	0	ı	н

[0102] [表11]

53				
到示化会物 番号	x	Y	m	R
1-91	CI N Me Me	О	1	н
1-92	CI N Bt St	0	1	н
1-93	Bt N. Me	0	1	н
1-94	Br N Me	٥	1	н
1-95	CF ₃ N	o	1	H
1-96	CF ₃ TN C1 Me	0	944	Ħ
1-97	CF3 Me	0	1	н
1-98	CF3 N N	0	1	н
1-99	Br N	0	1	н

[0103] [表12]

55				
所示化合物 番号	x	γ	m	R
1-100	C1 N	٥	1	н
1-101	Br JN Me Me	o	and .	H
1-102	tBu N Me	0	1	н
1-103	HC N Me	0	1	н
1-104	ÇN Ne Me	0		н
1-105	· CI Ne	0	E.	н
1-106	F No.	0	1	н
1-107	Br N Br N Me	0	1	н
1-108	CI W	٥	1	н

[0104] [表13]

	57					58
	化会物 备号	×	Y	m	R	
1-	-109	Me TN HO HO Me Me	0	1	н	
1	-110	Me Ne Me	0	2	H	
1	-111	Me N N N Me Me	0	3	н	
1	-112	Me No Me	S	1	H	
1	-113	Me IN HO Me Me	0	l	Me	
	-114	Me Ne Me	0	ı	MeO	
	1-115	Me TN HO Ne Me	o	1	Cı	
	1-116	Ç, N	0	1	Н	
	1-117	, Cir	s	ı	н	

[0105] [表14]

59				
所示化合物 當 号	х	Y	m	R
1118		0	à	н
1-119	(J ^N) Me	0	2	8
1-120	∭N, Me	0	3	Ħ
1-121	.↓↓\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	0	4	н
1-122	↓ N Ne	0	5	н
1-123	, JCN Me	0	1	MeO
1-124	√√n Me	0	1	Cl
1-125	√n Me	s	1	н
1-126		s	3	н

[0106] [表15]

61				
例示化合物 番 号	x	Y	m	R
1-127		0	l	н
1-128	N Et	\$	ı	н
1-129	III)	0	1	Ħ
1-130	∴ N Pr	0	1	C!
1-131	IPT	0	1	н
1-132	. On ir	s	1	Ħ
1-133	II,	0	1	н
1-134	N BE	o	1	н
1-135	NN	0	3	н

[0107] [表16]

OIH

0 1 H

0 1 H

[0108] 【表17】

1-142

1-143

1-144

65					66
與示化合物 番号	x	Y	m	R	
1-145	∭N Me	s	***	н	
1-146	Meo CN	0	1	н	
1-147	MeO N	0	2	н	
1-148	MeO N	0	3	н	
1-149	MeO N	0	4	Ħ	
1-150	Me Me	0	5	H	
1-151	Me Me	s	ı	н	
1-152	MeO N	s	2	н	
1-153	Me N	0	1	Me	

[0109] [表18]

	*				
例示化合物 番号	x	Y	m	R	
l-154	Me MeO↓↓N MeO↓↓N	o	2	Me	
1-155	MeO L N	0	1	F	
1-156	MeO N	٥	ŧ	Cl	
1-157	MeO N	0	1	н	
1-158	MeO N	0	2	н	
1-159	MeO N	0	1	MeO	
1-160	MeO N	s	1	н	
1-161	Meo N	٥	1	н	-
1-162	MeO N	s	1	н	

【0110】 【表19】

69				
到示化合物 蓋 考	x	Y	m	R
1-163	Meo N	0	1	н
1-164	MeO N	0	ı	н
1165	i Bu MeO N→	8	1	н
1-106	B to N	0	1	н
1-167	E to Th	o	ı	MeO
L-168	E to N	0	4.1	CI
1~169	E 10 N	0	2	н
1-170	E s O N	o	3	н
1-171	We E(O)	\$	1	н

[0111] [表20]

71				
例示化合物 番号	к	Y	ain .	R
1-172	8:0 N	S	4	Et
1-173	Pro N	0	1	н
1-174	Pro N	s	1	н
1-175	(Pro N	0	ì	н
1-176	19ro	О	3	н
1-177	BuO N	0	100	н
1-178	(Buo N	0	1	н
1-179	sBuO N	0	1	н
1-180	1840 N	0	1	н

[0112] 【表21】

73					74
例示化合物 番号	х	Y	m	R	
1-181	BuO N	0	1	Н	
1-182	Me N→ B ₂ O → N	0	1	Ħ	V
1-183	MeO No Me	0	1	н	
1-184	MeC N	0	1	Ħ	
1-185	E t O N N	0	ì	н	
1-188	F TN	o	1	H	
1-187	r C N →	0	1	н	
1-188	CI TIN	0	ı	н	
1-189	CI TN Et	٥	1	я	

[0113] [表22]

75				
所示化合物 番号	x	Y	m	R
1-190	Et N	0	***	н
1-191	Br Ne	٥	1	Н
1-192	CF3 We	0	1	н
1-193	CF3 CIN	٥	1	н
1-194	Me CF3	0	1	н
1-195	CF3 CIN	0	1	н
1-196	Br We Me Me Me	0	L	н
1-197	CI THE	٥	1	н
1-198	Br CV	0	2	н

【0114】 【表23】

77				
例示化合物 番 号	x	Y	m	R
1-189	t Bu N	0	1	н
1-200	HO N	0	ì	н
1-301	Me W Me	0	1	н
1-202	CI CIN	0	1	н
1-203	P Y Y	٥	1	Ħ
1-204	Br N	o	1	н
1-205	Me C1	0	1	н
1-206	Me Me HO N	o	ı	н
1-207	Me Ne	0	2	H

[0115] [表24]

79				
判示化合物 番号	Х	Y	m	Ř
1-208	Me Me HO N	0	3	Н
1-209	Me Mo Me Ho Me	S	i	н
1-210	Me Ne No Ne	0	1	Me
1-211	Me Me N HO Ne	0	i	MeO
1-212	Me Me HC N	٥	1	Cl
1-213	, IN NO	0	ı	н
1-214	Me √N	0	s	н
1-215		0	3	н
1-216	Me	0	4	н

[0116] [表25]

81				į
例示化合物 番 等	x	Y	m	R
1-217	↓ No	0	5	н
1-218	Me LUN	o	1	MeQ
1-219	Me No.	0	ı	Cl
1-220	, CY	s	1	н
1-221	\(\text{\text{Me}}\)	\$	3	н
1-555	Z Z -H	o	1	н
1-223		s	1	н
1-224	\(\text{N}\) \(\text{N}\) Pr	0	ı	н
1-225		o	1	Cl

[0117] [表26]

83				
列示化合物 書 号	x	γ	m	R
1-226	iPr (IV)	٥	ı	н
1-227	iPr (IN)	s	1	н
[-228	J. Su	0	1	Ħ
1-229	Sa. No. No. No. No. No. No. No. No. No. No	0	1	н
1-230	Se No. 10 No. 1	o	3	н
1-231		s	1	н
1-232	ÇZZ Me	o	1	н
1-233		a	1	Ħ
1-234	Q'i	0	1	Ħ

[0118] [表27]

85				
例示化合物 番号	×	Y	m	R
1-235	ÇIN N	S		н
1-236	∫() Me	0	1	н
1-237	Me Me Me	0	ı	н
1-238	Me Vie	0	2	н
1-239	Me Me Me Me HO Me	0	3	н
1-240	Me Me HO Me	0	4	н
1-241	Me Me Me	s	1	н
1-242	Me Me Me	0	1	MeO

[0119] [表28]

87				
對示化合物 番号	x	Y	m	R
1-243	Me Me Me	0	1	а
1-244	Me Me Me	0	1	F
1-245	Me Me Me	٥	1	CF,
1-246	Me Me HO Me	0	1	E:
1-247	Me Ho Hi	۰	1	н
1-248	Me E	0	2	Ħ
1-249	Me Ke El	٥	1	MeO

[0120]

	* * [7	長29】		
例示化合物 番号	*	Ÿ	m	В
1-250	Me We NA	0	ì	н

【0122】 【表30】

表<u>2</u> 【0121】 【化10】

0]
$$X \longrightarrow CH_2 \xrightarrow{m} Y \longrightarrow 0$$

$$S \xrightarrow{NH} NH$$

89					9
例示化合物 番号	x	Y	щ	R	
2-1	© ^K ≻	0	ı	Н	
2-2	© NN NN NN NN NN NN NN NN NN NN NN NN NN	0	2	H	
7-3	© N →	0	3	н	
2-4	CIN >	o	4	н	
2-5	(C) N →	0	5	MeO	
2-6	CTN N	s	ı	н	
2-7	H N N	o	1	MeO	
2-8	ZZ Z	o	1	Cŧ	
2-9	(J ⁿ)≻	o	1	Ме	

【0123】 【表31】

91				
例示化合物 番 号	x	Y	m	R
5-10	© N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	s	1	MeO
2-11	N N Me	0	1	Ħ
2-12	©ZZ-Me	0	2	Ħ
2-13	CYN. N. Y. Ye	O	3	н
2-14	(C)N Ne	o	4	н
2-15	N Ne Me	0	5	н
2-16	N Me	s	1	н
2-17	()N Ne Me	s	2	н
2-18	(C)N Ne	0	1	MeO

[0124] [表32]

93				
例示化合物 番号	x	Y	m	R
2-19	∭N>- Me	o	1	EŧO
2-29	(C)N N Me	0	1	C1
2-21	N N Me	0		F
2-22	CN N≥ Me	0	l	Me
2-23	C\n\ Me	0	1	iPr
2-24	()N Ne	o	2	Et
2-25	CIN→ Me	s	1	Cl
2-26	ŬN Me	s	1	Me
2-27	◯lh>	0	1	н

【0125】 【表33】

95				
例示化合物 番号	х	Y	m	R
2-28	(In) Et	0	2	н
2-29	(C)N Et	0	3	t8u
2-30	(CN) Et	0	1	Me
2-31	CIN- Et	0	1	MeO
2-32	(IN)→ Et	s	1	н
2-33	CZZ E:	\$	1	PrO
2-34	(N _N bt	s	1	Me
2-35	O'N Pr	0	ì	н
2-36	(N) Pr	0	3	н

【0126】 【表34】

97				
例示化合物 番 号	x	Y	m	R
2-37	()N Pr	0	ı	F
2-38	(C)N Pr	s	ı	н
2-39	(NN NN N Pr	٥	1	н
2-40	N N I Pr	0	2	н
2-41	(N N i Pr	s	ı	н
2-42	OTN i Pr	s	5	C1
2-43	CIN- Bu	0	1	н
2-44	CIN- Bu	0	4	Ħ
2-45		s	1	н

【0127】 【表35】

99					10
例示化合物 番 号	x	γ	m	R	
2-46	MeO N	0	ı	н	
2-47	MeO NA	0	3	н	
2-48	MeO N	S	1	н	
2-49	MeO No Me	0	1	н	
2~50	MeO N Me	o	2	н	
2-51	MeO Ne	٥	3	н	
2-52	MeO Ne	٥	4	н	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
2-53	MeO IN Me	0	5	Н	
2-54	MeO N	s	1	н	

[0128] [表36]

101				1
列示化合物 署 号	Х	Y	m	R
2-55	Me O No Me	s	2	я
2-56	MeO CN Ne Me	0	1	Me
2-57	MeO No Me	0	į	MeO
2-58	MeO No Me	0	1	F
2-59	MeO N Me	0	i	СІ
2-60	MeO N	o	ı	Ħ
3-61	MeO N	0	2	н
2-62	MeO IN Et	0	. 1	MeO
2-63	MeO TN bi	s	1	н

[0129] [表37]

103	1347			
例示化合物 番 号	x	Y	m	R
2-64	MeO IN	٥	1	н
2-65	MeO CIN	s	1	н
2-66	MeO CIN	o	1	н
2-67	MeO N	0	l	н
2-68	MeO N	s	1	н
2-89	E tO N	0	1	н
2-70	E t O N N Me	0	1	MeO
2-71	E to N	o	1	CI
2-72	B to CYN	0	2	н

[0130] [表38]

105				
例示化合物 番号	x	Y	m	R
2-73	B to N	0	3	H
2-74	EtO N	s	ŧ	н
2-75	E to N Me	s	4	Et
2-76	Pro N	С	1	H
2-77	Pro N	s	1	н
2-78	i Pro Ne	٥	1	н
2-79	iPro N Me	0	3	н
2-80	BuO N Me	0	1	н
2-81	18u0 N	0	1	н

【0131】 【表39】

107				
例示化合物 番号	х	Y	m	R
2-82	sBuO N Me	0	1	н
2-83	t BuO NNN NNNN Me	0	1	Ħ
2-84	BuO Pr	0	1	н
2-85	BgO N Ne	0	1	н
2-86	MeO T N Me Me	o	1	н
2-87	MeO N Br N Me	0		н
2-88	EtO N F Me	0	1	н
2-89	F CNN	٥	1	н
2-90	₽ CIN	٥	1	н

[0132] [表40]

109					1
例示化合物 番号	x	γ	в	R	
2-91	C1 N Me	0	1	н	
2-92	CI N Et Et	0	1	н	
2-93	Et N Ne	0	1	н	
2-94	Br N Me	0	1	н	
2-95	CF ₃ N N Br Me	0	1	н	
2-96	CF ₃ N	o	1	н	
2-97	CF ₅ Me	0	1	н	
2-98	CF3 CN	0	1	н	A
2-99	Br N Me N Me Me	٥	1	ਸ਼	

[0133] [表41]

	13()				200
111					112
例示化合物 番 号	x	Y	m	R	
2-100	CI N Me	٥	1	н	
2-101	Br N N Me Me	0	1	н	
2-102	ι Bu N N Me	0	1	н	
2-103	HO N N Me	0	1	н	
2-104	N Me Me	٥	ı	н	
2-195	CI NN CI Me	0	•	н	
2-108	F N F Me	0	ì	н	
2-107	Br N BzO N Me	0	1	н	
2-108	C1 Me	٥	1	Ħ	

[0134] [表42]

	(38)				14 (1)
113					114
列示化合物 番号	x	Y	an	R	
2-169	Me N HO N Me Me	0	1	н	
2~110	Me No Me	a	2	н	
2-111	Me N HO Ne	0	3	н	
2-112	Me Ne Me	s	1	н	
2-113	Me No Me Me	o	1	Me	
2-114	Me Ne Me	o	*	MeO	
2-115	Me XXIII HO XXIII Me Me	0	ı	CI	-
2-116		0	1	н	
2-117	- Car	s	1	н	

[0135] [表43]

115					i
例示化合物 器 号	х	Y	m	R	
2-118	∭N N Me	0	ı	Н	
2-119	N N Mc	0	2	н	
2120	∭N Me	o	3	н	
2-121	√ N N Me	o	4	Ħ	
5-155	√√N Ne	0	5	н	
2-123	ĹŢN Me	o	1	MeO	
2-124	↓ (N) Me	o	1	Cl	
2-125	I N Ne	s	ı	н	
2-126	.∫(N) Me	s	3	н	

[0136] [表44]

	(60)			
117 例示化合物 番号	x	Y	m	R
2-127	. ○ N et	o	1	н
2-128	, C, r,	s	ı	Ħ
2-129	. ĹŢŅ Pr	٥	L	н
2-130	.C\n\ pr	0	1	CI
2-131	√√N i Pr	o	1	н
2-132	↓ N N i Pr	s	1	н
2-133	J N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	0	1	н
2-134	↓ N Bz	o	ı	н
		*******	1	

【0137】 【表45】

2-135

119				
例示化合物 番 号	x	Y	m	R
2-136	, CN Bz	s	1	н
2-137	(TN Ne Me	o	1	н
2-138	() N	0		н
2-139	Ç N N Θ z	0	1	н
2-140	ÇN N N Bz	s	ı	H
2-141		0	1	Ħ
2-142	Ċ\N Ne	0	1	н
2-143	\(\tau_N\) Me	0	1	Ħ
2-144	N> Me	0	1	н

[0138] [表46]

121					12
列示(t合物 番号	x	Y	m	R	
2-145	N Me	\$	1	н	
2-146	Me O N	0	1	н	
2-147	MeO CON	0	2	H	
2-148	Me O N	0	3	Ħ	
2-149	Me Me	0	4	н	
2-150	MeO N	0	5	н	
2-151	Meo N	s	1	Ħ	
2-152	Meo N	5	8	н	-
2-153	Me MeO N	0	1	Me	

【0139】 【表47】

123				
列示化合物 番 号	x	Y	m	R
2-154	Meo CYN	0	2	Me
2-155	Me M	٥	1	P
2-156	Me MeO↓↓N MeO↓↓N	0	1	CI
2-157	MeO N	o	1	н
2-158	Meo CN	o	2	н
2-159	MeO N	0	1	MeO
2-160	MeO N	s	1	н
2-161	MeO N	0	1	н
2-162	Pr MeO N	s	**4	н

[0140] [表48]

125				1
例示化合物 番号	×	Y	m	R
2-183	MeO N	0	1	н
2-184	i Bu MeO N	0	1	X.
2-165	i Bu Neo ◯N	s	1	н
2-166	B to N	0	1	н
2167	E to N	0	1	MeO
2-168	Eto N	0	1	Ci
2-169	E tO N	0	8	н
2-170	B t O N	o	3	н
2-171	B t O T N	s	1	н

[0141] [表49]

127				
例示化合物 番 号	x	Y	m	R
2-172	E LO N	8	4	Et
2-173	Pro N	o	1	H
2-174	Pro N	s	1	Н
2-175	iPro N	0	1	Ħ
2-176	iPro N	o	3	н
2-177	BuO N	0	1	н
2-178	i BuO	0	1	н
2-179	gBuO No	0	1	н
2-180	t BuO	0	1	Н

【0142】 【表50】

129				
到示化合物 番号	x	Y	ers	R
2-181	BuO N	a	1	н
2-182	Bg O	0	1	н
2-183	Me Me NeO N	٥	1	н
2-184	MeO NO	0	1	н
2-185	EtO Ne	0	1	н
2-186	F C	0	1	н
2-187	F Ne	0	1	н
2-188	C1 N	٥	1	н
2-189	CI N Et	0	ı	н

【0143】 【表51】

131				
例示化合物 备 号	x	Y	113	R
2-190	Et N	0	1	н
2-191	Br N	0	1	н
2-192	CF3 We	0	1	H
2-193	CF3 CN	0	1	н
2-194	Ne CF ₈	0	1	н
2-195	CF3 CN	0	1	н
2-196	Br N	0	1	н
2-197	C1 TN	0	1	H
2-198	Br N	0	2	Ħ

【0144】 【表52】

133				
<u></u> 務示化合物 番号	×	Y	m	R
2-199	Me N N ≀Bu N	0	1	н
2-200	HO N	o	1.	н
2-201	Me N Me	0	ı	н
2-202	CI CIN	0	1	н
2~203	F X N	0	1	н
2-204	Bzo N	0	1	н
2-205	Me C	0	1	н
2-206	Me Me HO N	o	1	H
2-207	Me HO N	0	2	н

【0145】 【表53】

135					13
判示化合物 番 号	x	Y	m	R	
2-208	Me Me Ho No Me	o	3	Н	
2-209	Mc Me HO Me	s	1	н	
5-510	Me Me HO N	0	ı	Me	
2211	Me Me HO Ne	0	ı	MeO	
2-212	Me Me HO N	0	1	Cl	
2-213	Me A	0	1	Ħ	
2214	\(\times_{\text{N}}^{\text{N}}\)	o	2	H	
2-215	Me LON	0	3	н	
2-216	Me Ch	o	4	н	

【0146】 【表54】

137				
例示化合物 番 号	х	Y	m	R
2-217	Me N	0	5	H
2-218	Me N	o	ì	MeO
2-219	Me N	0	1	Cl
3-220	.(),	5	l	н
2-221	.↓○\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	s	3	н
2-223	, N N N N	0	1	н
5-553		s	1	н
2-224	Pr N	o	1	н
2-225	Pr N	0	ı	CI

【0147】 【表55】

	(11)			
139				
列示化合物 番号	X	Y	m	R
2-226	(Pr	0	1	н
2-227	LT)	\$	ı	н
2-228	Bo-Z-X	0	1	н
2-229	AN CONTRACTOR	0	1	н
2-230	Bz N	0	3	Ħ
2-231	Bz N	s	\$	н
2-232	Ç, N Me Me	0	1	н
2-233	STA BE:	o	1	н
2-234	B.E.	0	1	н

[0148]

* * [表56]

	A. A. 1940 0.1			
 例示化含物 番号	x	¥	m	R
2-235	Br N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	s	1	н
2-236	Me N Me	0	1	Н

表 3 【0 1 4 9】 【化 1 1】

【表57】

例示化合物 番 号	х	Y	m	R
31	(CINN → H	0	1	н
3-2	C N N	o	2	н
33	©\n\ N N	o	3	н
3-4	(X) N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	0	4	н
3-5	SH ZH	0	101	MeO
3-6	H N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	s	1	н
3-7	CIN-	0	1	MeO
3-8		0	1	Cı
3-9		0	1	Me

[0151] [表58]

143				1
例示化合物 番号	x	Y	m	R
3-10	(XN) N> N	S	ŧ	MeO
3-11	(N N Me	0	1	н
3-12	(C)N N Me	0	2	н
3-13	(◯TN) Me	a	3	Н
3-14	(C)N N Me	0	4	н
3-15	(C)N N Me	0	5	н
3-15	(CIN → Me	s	1	н
3-17	N N Me	s	2	н
3-18	(C)N Me	0	1	MeO

[0152] [表59]

145					14
例示化合物 #4号	x	Y	m	R	
3-19	()N N Me	0	1	EtO	
3-20	(CN) N Me	0	1	Cl	
3-21	©Z, Me	0		F	
3-22	()N Ne Me	0	1	Me	
3-23	○N Ne	0	1	iPr	
3-24	©ZN Ne	٥	2	Et	
3-25	CN N Me	s	1	Cı	
3-26	N Me	s	1	Me	***************************************
3-27	ÇN Et	0	1	н	

[0153] [表60]

147				1
例示化合物 番号	x	Y	713.	R
3-28	Et.	0	2	н
3-29	CN Et	0	3	tBu
3-36		o	1	Me
3-31	ZZ-6:	0	1	MeO
3-32	C N Et	s	1	H
3-33		s	1	PrO
3-34	Z, ω	s	1	Me
3-35	₩ Pr	٥	ı	н
3-36	ÇN, Pτ	٥	3	н

[0154] 【表61]

	(10)			
149				
料示化合物 番 号	х	Y	m	R
3-37	© _p Pr	0	1	p
3-38	(IN)→ Pr	s	1	н
3-39	○N N 1 Pr	o	1	H
3-40	(IN)→ 1 Pr	0	2	н
3-41	(TN) 1 Pr	s	1	Ħ
3-42	() _N ≻	s	5	CI
3-43	Çĭ <mark>N</mark> ≻ Bu	0	ı	н
3-44	€u Bu	o	4	Ħ
3-45	()N N N	s	,	Ħ

[0155] [表62]

151				
例示化合物 養 号	x	Y	m	R
3-46	MeO N	0	ì	н
3-47	MeO N	0	3	н
3-48	MeO N	s	1	н
3-49	MeO No	0	ı	н
3-50	MeO No Me	0	2	н
3-51	MeO N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	o	3	Ħ
3-52	MeO N N Me	0	4	н
3-53	MeO N Me	0	5	н
3-54	MeO N	s	1	н

【0156】 【表63】

153	(78)			1
例示化合物 备号	X	Y	m	R
3-55	MeO No	s	2	н
3-56	MeO Ne	0	ŧ	Me
3-57	MeO No	0	1	MeO
3-58	MeO N Me	0	1	F
3-59	MeO Neo	0	1	CI
3-69	MeO N	o	1	н
3-61	MeO Kt	0	2	н
3-82	MeO N Et	0	1	MeO
			Ι.	

[0157] [表64]

155	(79)			
例示化合物 番号	X	Y	BC.	R
3-64	MeO N	0	1	Ħ
3-65	MeO N	s	1	н
366	MeO No i Pr	o	1	н
3-67	MeO No i Bu	0		н
3-68	MeO N	s	1	н
369	E tO Ne	٥	1	н
3-70	EtO N Me	0	1	MeO
3-71	BtO N Me	0		CI
	······································		7	1

[0158] [表65]

157

158

例示化合物 蓋 号	х	¥	m	R
3-73	B:0 N N Me	0	3	Н
3-74	EtO N Me	s	1	н
3-75	EtO NAME	s	4	Et
3-76	Pro N N Me	0	1	н
3-77	Pro Ne	s	1	н
3-78	IPro CIN	0	1	н
3-79	iPro N	a	3	н
3-80	BuO N N Me	0	1	н
3-81	i BuO N Me	0	1	н

【0159】 【表66】

159					16
例示化合物 番号	x	Y	m	R	
3-82	sBu0 NN Ne	0	ı	н	
3-83	t BuO NN→ Ne	٥	1	н	
3-84	Buo N Pr	0	**	н	
3-85	B _{ZO} N N Me	0		н	
3-86	MeO N Me Me	0	1	н	
3-87	MeO N N N Me	0	1	н	
3-88	E tO N F Me	0	1	н	
3-83	F N N F Me	0	1	Ħ	
3-90	₽ ÇÎN	0	1	н	-

【0160】 【表67】

161				
例示化合物 番 号	x	Y	m	R
3-91	CI N Me Ne	٥	1	Ħ
3-92	C1 N Et	0	1	н
393	Et N N Me	0	1	н
3-94	Br N N Me	0	1	н
3-95	CF ₃ N N Br Me	0	1	Н
3-96	CF ₃ N	o	1	н
3-97	CF3 Me	0	1	H
3-98	CF ₈ N	0	1	н
3~99	Br N Me Ne Me	0	1	н

[0161] [表68]

163	-04/			1
所示化合物 番 号	x	Y	ш	R
3-100	CI N	0	ı	н
3-101	Br N N Me Me	0	1	н
3-102	t Bu N Me	0	1	н
3-103	HO N N Me	0	1	н
3-104	N Me Me	0	1	н
3105	C1 N N C1 Me	0	1	н
3-136	F N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	0	1	н
3-107	Br N Bro Me	o	1	н
3-108	C1 Me	0	1	н

[0162] [表69]

165				1
例示化合物 書 号	x	Y	m	R
3-109	Me N HO Ne Me	0	1	Ħ
3-110	Me N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	٥	2	н
3-111	Me Ne Me	o	3	н
3-112	Me Ne Me	s	1	н
3-113	Me No Me Me	0	1	Me
3114	Me N HO N Me Me	o	1	MeO
3-115	Me Ne Me	٥	1	Сl
3-116	L L L L L L L L L L L L L L L L L L L	0	Į.	н
3-117	CT">	s	1	н

[0163] [表70]